

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 09-221476

(43)Date of publication of application : 26.08.1997

(51)Int.Cl.

C07D223/16  
 A61K 31/55  
 A61K 31/55  
 C07D243/12  
 C07D243/14  
 C07D401/06  
 C07D401/10  
 C07D401/12  
 C07D401/14  
 C07D403/10  
 C07D403/10  
 C07D403/12  
 C07D405/12  
 C07D409/06  
 C07D413/10  
 C07D413/10  
 C07D417/06  
 C07D417/10  
 C07D471/04

(21)Application number : 08-354761

(22)Date of filing : 16.12.1996

(71)Applicant : OTSUKA PHARMACEUT CO LTD

(72)Inventor : OGAWA HIDENORI  
 KONDO KAZUMI  
 YAMASHITA HIROSHI  
 SUGA KEIZO  
 MATSUZAKI NORIYUKI  
 SHINOHARA YUICHI  
 TANADA YOSHIHISA  
 KURIMURA MUNEAKI  
 TOMINAGA MICHIAKI  
 YABUUCHI YOICHI

(30)Priority

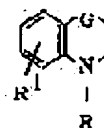
Priority number : 07348123    Priority date : 15.12.1995    Priority country : JP

## (54) MEDICINAL COMPOSITION

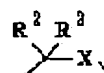
(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a medicinal composition, comprising a new compound, effectively used as a vasopressin antagonist, a vasopressin agonist, etc., selective according to various therapeutic purposes such as a tablet or a powder and useful as a medicinal preparation.

SOLUTION: This medicinal composition comprises a benzoheterocyclic derivative represented by formula I [G is a group represented by formula II (R1 is H, a lower alkyl, etc.; R2 is H, OH, etc.; R3 is H or an OH-



I



II

substituted lower alkyl; X is methylene, a single bond, etc.), etc.; R is adamantylcarbonyl, a cycloalkylcarbonyl, etc.; R1 is same as that described above] and its salt, e.g. 7-chloro-5-[N-methyl-N-(2-diethylaminoethyl)amino]carbonylmethyl-(2-methoxy-4-ethoxybenzoyl)-2,3,4,5-tetrahydro-1H-benzazepine hydrochloride. The compound represented by formula I is obtained by carrying out the usual amide bond forming reaction of, e.g. a benzoheterocyclic compound represented by formula III with a carboxylic acid according to, e.g. a mixed acid anhydride method or an active ester method.

---

#### LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 30.01.1998

[Date of sending the examiner's decision of rejection] 20.11.2002

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

Drawings are not displayable due to the volume of the data (more than 200 drawings).

\* NOTICES \*

JPO and NCIP1 are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

- 1.This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
- 2.\*\*\* shows the word which can not be translated.
- 3.In the drawings, any words are not translated.

CLAIMS

[Claim(s)]

[Claim 1] General formula [\*\* 1]

The inside G of [type is [Formula 2].

\*\*\*\*\*. R1 -- as a hydrogen atom, a halogen atom, a low-grade alkyl group, a lower alkoxy group, a hydroxyl group, a low-grade alkanoloxo radical, and a substituent -- a low-grade alkyl group and low-grade alkanoyl -- a radical -- the aminocarbonyl lower alkoxy group which has had the low-grade alkyl group as the amino lower alkoxy group which has had the radical chosen from the group, the amino group which has had the low-grade alkyl group as a substituent, a carboxy permutation lower alkoxy group, a low-grade alkoxy carbonyl permutation lower alkoxy group, or a substituent is shown. R2 -- radical-NR four R5 (R4 and R5 are the same -- or -- differing -- a hydrogen atom --) the benzoyl which has had the halogen atom as a substituent on the low-grade alkyl group which has had the hydroxyl group as a substituent, or a phenyl ring is shown. ; hydrogen atom; -- hydroxyl-group; -- lower alkoxy group; -- carboxy permutation low-grade alkyl group; -- cyano permutation low-grade alkyl group; -- tetrazolyl group permutation low-grade alkyl group; -- low-grade alkanoloxo radical permutation low-grade alkyl group; -- a low-grade alkoxy carbonyl permutation -- low-grade -- as an alkyl group; substituent A low-grade alkyl group amino permutation low-grade alkanoloxo radical; which has had -- low-grade alkoxy carbonyl group permutation lower alkoxy group; -- carboxy group permutation lower alkoxy group; -- low-grade alkanoyl radical; or radical-(O) m-A-(CO) uNR six R7 (m and u show 0 or 1, respectively.) However, m and u must not be 0 simultaneously. A shows a low-grade alkylene group. It differs and R6 and R7 show the same or the phenyl group which has had the halogen atom on the amino permutation low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a hydrogen atom, a lower alkoxy group, a low-grade alkyl group, and a substituent, a carbamoyl group permutation low-grade alkyl group, an adamantyl radical permutation low-grade alkyl group, a low-grade alkyl sulfonyl group, or a phenyl ring. R6 and R7 may form the saturation heterocycle of five to 7 membered-ring, without minding through a nitrogen atom or an oxygen atom with the nitrogen atom which these combine. this heterocycle top -- a low-grade alkyl group and phenyl -- low-grade -- an alkyl group -- the radical chosen from the group may permute. It is shown. R3 shows a hydrogen atom or a hydroxylation low-grade alkyl group. Moreover, these may become together and R2 and R3 may form an oxo-radical, a low-grade alkylidene radical, a low-grade alkoxy permutation low-grade alkylidene radical, a low-grade alkoxy carbonyl permutation low-grade alkylidene radical, or a phenyl permutation low-grade alkylidene radical. R On a pyridine ring, as a substituent the phenyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, and pyridyl -- a radical -- as a substituent on the pyridyl carbonyl group; 9-oxo-fluorenyl group; quinoline ring which has had the radical chosen from the group quinolyl carbonyl group; which has had the phenyl group -- adamantyl carbonyl group; -- as a substituent on a thiophene ring thienyl carbonyl group; which has had the phenyl group -- thiazolyl carbonyl group; which has had the phenyl group as a substituent on a thiazole ring -- a cycloalkyl carbonyl group or \*\* -- [Formula

3]

(p shows 1 or 2.) R8 shows a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, a hydroxyl group, the amino group that has had the low-grade alkanoyl radical as a substituent, a nitro group, a halogen atom, or a lower alkoxy group. R9 is a radical. -- It is NR ten R11 (R10 shows the low-grade alkanoyl radical which has had the halogen atom as a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, or a substituent.). R11 -- as a low-grade alkyl group and a substituent -- a halogen atom -- and -- a hydroxyl group -- the low-grade alkanoyl radical which has had the radical chosen from the group -- a cycloalkyl radical and phenyl ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and a halogen -- an atom -- the phenyl low-grade alkyl group which it may have the radical chosen from the group, and has had the hydroxyl group into the low-grade alkyl group part -- The phenoxy low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, On a phenyl ring, as a substituent A low-grade alkyl group, a phenyl group, a lower alkoxy group, A halogen atom permutation low-grade alkyl group, the amino group which has had the low-grade alkyl group as a substituent, a nitro group, the low-grade alkanoyl radical permutation amino group, and a halogen -- an atom -- the phenoxy low-grade alkanoyl radical which it may have the radical chosen from the group, and has had the halogen atom as a substituent in a part for a low-grade alkanoyl base -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and pyridyl low-grade alkyl group and phenyl -- low-grade -- an alkyl group -- the aminocarbonyl radical which has had the radical chosen from the group -- The low-grade alkoxy carbonyl group which has had the halogen atom as a substituent, A low-grade alkoxy permutation low-grade alkanoyl radical, a low-grade alkanoloxo permutation low-grade alkanoyl radical, a phenoxy low-grade alkoxy carbonyl group, a benzofuril carbonyl group, a benzoimidazolyl carbonyl group; quinolyl carbonyl group, a quinolyl oxy-permutation low-grade alkanoyl radical, a phenyl low-grade alkoxy carbonyl group, and \*\* -- [Formula 4]

A tetrahydro iso quinolyl carbonyl group, a benzoyl low-grade alkyl group, a quinoline ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and oxo-one -- a radical -- the tetrahydro quinolyl oxy-permutation low-grade alkanoyl radical which has had the radical chosen from the group -- A low-grade alkyl sulfonyl group, a pyridyl low-grade alkoxy carbonyl group, A fluorenyl low-grade alkoxy carbonyl group, a low-grade alkenyloxy carbonyl group, A tetrahydro naphthyloxy permutation low-grade alkanoyl radical, a phenyl low-grade alkenyl carbonyl group, a piperidine ring top -- as a substituent -- a low-grade alkanoyl radical and a low-grade alkoxy carbonyl group -- and low-grade -- an alkyl group -- the piperidinyl low-grade alkoxy carbonyl group which has had the radical chosen from the group is shown. R10 and R11 [ moreover, ] an iso indoline ring may be formed with the nitrogen atom which these combine. ; hydrogen atom; -- low-grade alkanoloxo radical; -- low-grade alkanoyl radical; -- lower alkoxy group; -- as a substituent on a phenyl ring benzoyl; cycloalkyl radical; which has had the low-grade alkyl group -- low-grade alkyl group; -- low-grade alkylthio group; -- phenyl low-grade alkanoyl radical; which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring -- a phenyl ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group -- A lower alkoxy group, a phenyl lower alkoxy group, a hydroxyl group, a low-grade alkanoloxo radical, A halogen atom permutation lower alkoxy group, a nitro group, the amino group that has had the low-grade alkanoyl radical as a substituent, the amino permutation which has had the low-grade alkyl group as a phenyl group and a substituent -- a lower alkoxy group -- as a substituent on the phenyl group; phenoxy group; phenyl ring which has had the radical chosen from the group On a phenyl ring, The phenoxy low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group; as a substituent phenyl low-grade alkyl group; which has had the low-grade alkyl group -- ANIRINO low-grade alkyl group; which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring -- a phenyl ring top -- as a substituent -- a halogen atom -- In a low-grade alkoxy carbonyl group list, as a substituent as a low-grade alkyl group and a substituent the amino permutation which has had the low-grade alkyl group -- low-grade -- an alkyl group -- the aminocarbonyl which has had the radical chosen from the group -- a radical -- as a substituent on the phenyl lower alkoxy group; phenyl ring which has had the radical chosen from the group On a phenyl ring, The benzoyl lower alkoxy group which has had the halogen atom; as a substituent phenyl low-grade alkenyl radical; which has had the halogen atom -- the benzoyl which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a



phenyl ring -- low-grade -- alkyl group; pyrrolidinyl permutation lower alkoxy group; -- a nitrogen atom -- the heterocycle radical (this heterocycle radical -- as a substituent -- a low-grade alkyl group --) of the monocycle of five to 11 membered-ring of the saturation which has an oxygen atom or 1-4 sulfur atoms, or partial saturation, or 2 \*\*\*\* A phenyl group, a low-grade alkanoyl radical, a halogen atom, It considers as an alkylamino carbonyl group; substituent. a phenyl low-grade alkyl group and oxo-one -- a radical -- you may have 1-3 radicals chosen from the group --; cyclo alkenyl radical; phenyl -- low-grade -- The amino sulfonyloxy radical which has had the low-grade alkyl group; cyano group; or radical-(A) m-CHR 12R13 (A is the same as the above.) R12 shows a hydrogen atom, a hydroxyl group, or a low-grade alkanoloxo radical. R13 shows the phenyl low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on the phenyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, or a phenyl ring. m shows 0 or 1. It is shown. . X shows methylene group, single bond, and radical =CH- or radical-NR14- (R14 shows a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, or a low-grade alkanoyl radical.). Y shows -NRA- (RA shows hydrogen atom, low-grade alkoxy carbonyl permutation low-grade alkyl group, carboxy permutation low-grade alkyl group, or radical-ACONRBRC.). RB and RC are the same here -- or it differs and a hydrogen atom or a low-grade alkyl group is shown. Moreover, without minding through a nitrogen atom or an oxygen atom with the nitrogen atom which these combine, it may join together mutually and this RB and RC may form the saturation heterocycle of five to 7 membered-ring. The low-grade alkyl group may permute on this heterocycle. It is shown. R2 [ however, ] -- radical-NR four R5 (R4 and R5 are the same -- or it differs and a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, or benzoyl is shown.), a hydrogen atom, a hydroxyl group, a low-grade alkoxy carbonyl group permutation lower alkoxy group, a carboxy group permutation lower alkoxy group, a lower alkoxy group, a low-grade alkanoloxo radical permutation low-grade alkyl group, and radical-(O) m-A-(CO) uNR six R7 (m shows 1 and u shows 0 or 1.) R6 and R7 [ the same or ] [ whether it differs and a hydrogen atom or a low-grade alkyl group is shown and ] Form the saturation heterocycle of five to 6 membered-ring, without R6 and R7 minding through a nitrogen atom or an oxygen atom with the nitrogen atom which these combine (the low-grade alkyl group may permute on this heterocycle). or;R in which amino permutation low-grade alkanoloxo radical; which has had the low-grade alkyl group as a substituent, or R2 and R3 become together, and they form an oxo-radical or a low-grade alkylidene radical -- \*\*. -- [Formula 5]

When it comes out, and it is and R8 shows a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, a hydroxyl group, a halogen atom, a lower alkoxy group, or the amino group, respectively, R9 must not be a hydrogen atom and R9 is a radical. -- It is NR ten R11. R11 Low-grade alkanoyl radical, a phenyl low-grade alkoxy carbonyl group or phenyl ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group, the amino group, and the low-grade alkanoyl radical permutation amino group -- and -- a lower alkoxy group -- don't be the phenoxy low-grade alkanoyl radical which has had 1-3 radicals chosen from the group. Moreover, R1 must not be the phenyl group which R9 has had the hydroxyl group, the low-grade alkyl group, the lower alkoxy group, or the low-grade alkanoloxo radical as a substituent on a phenyl ring, when R2 is a hydrogen atom, the amino group, a mono-low-grade alkylamino radical, or a JI low-grade alkylamino radical in a hydrogen atom, or R2 and R3 become together and they form an oxo-radical. R9 [ moreover, ] -- \*\* -- [Formula 6]

(n shows 1 or 2) and G -- \*\* -- [Formula 7]

When (R2 and R3 are the same as the above) is shown, X must not be methylene group or radical =CH-. Moreover, when one side of R10 and R11 is a hydrogen atom, another side must not be a low-grade alkyl group. Moreover, when R1 and R2 show a hydrogen atom simultaneously, R must not be a non-permuted pyridyl carbonyl group, a non-permuted thienyl carbonyl group, a non-permuted thiazolyl carbonyl group, or a cycloalkyl carbonyl group. The amino permutation low-grade alkanoloxo radical which R3 has a hydrogen atom and R2 has furthermore had the low-grade alkyl group as a hydrogen atom and a substituent, a low-grade alkoxy carbonyl group permutation lower alkoxy group, a hydroxyl group, a lower alkoxy group, radical-(O) m-A-(CO) uNR six R7 (m shows 1 and u shows 0 or 1.) R6 and R7 are the same -- or it differs and a hydrogen atom or a low-grade alkyl group is shown. Or whether radical-NR

four R5 (R4 and R5 are the same -- or it differs and a hydrogen atom or a low-grade alkyl group is shown.) is shown Or R9 is a radical, when R2 and R3 become together and an oxo-radical or a low-grade alkylidene radical is shown. -- It is NR ten R11 (R10 shows a low-grade alkyl group, and R11 shows a low-grade alkyl group.). don't be a hydrogen atom, a low-grade alkylthio group, a lower alkoxy group, or a low-grade alkyl group. ] The remedy constituent containing at least one sort which came out and was chosen from the benzoheterocycle derivative expressed and its salt.

[Claim 2] General formula [\*\* 8]

The inside G of [type is [Formula 9].

\*\*\*\*\*. R1 -- as a hydrogen atom, a halogen atom, a low-grade alkyl group, a lower alkoxy group, a hydroxyl group, a low-grade alkanoloxyl radical, and a substituent -- a low-grade alkyl group and low-grade alkanoyl -- a radical -- the aminocarbonyl lower alkoxy group which has had the low-grade alkyl group as the amino lower alkoxy group which has had the radical chosen from the group, the amino group which has had the low-grade alkyl group as a substituent, a carboxy permutation lower alkoxy group, a low-grade alkoxy carbonyl permutation lower alkoxy group, or a substituent is shown. R2 -- radical-NR four R5 (R4 and R5 are the same -- or -- differing -- a hydrogen atom --) the benzoyl which has had the halogen atom as a substituent on the low-grade alkyl group which has had the hydroxyl group as a substituent, or a phenyl ring is shown. ; hydrogen atom; -- hydroxyl-group; -- lower alkoxy group; -- carboxy permutation low-grade alkyl group; -- cyano permutation low-grade alkyl group; -- tetrazolyl group permutation low-grade alkyl group; -- low-grade alkanoloxyl radical permutation low-grade alkyl group; -- a low-grade alkoxy carbonyl permutation -- low-grade -- as an alkyl group; substituent A low-grade alkyl group amino permutation low-grade alkanoloxyl radical; which has had -- low-grade alkoxy carbonyl group permutation lower alkoxy group; -- carboxy group permutation lower alkoxy group; -- low-grade alkanoyl radical; or radical-(O) m-A-(CO) uNR six R7 (m and u show 0 or 1, respectively.) However, m and u must not be 0 simultaneously. A shows a low-grade alkylene group. It differs and R6 and R7 show the same or the phenyl group which has had the halogen atom on the amino permutation low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a hydrogen atom, a lower alkoxy group, a low-grade alkyl group, and a substituent, a carbamoyl group permutation low-grade alkyl group, an adamantyl radical permutation low-grade alkyl group, a low-grade alkyl sulfonyl group, or a phenyl ring. R6 and R7 may form the saturation heterocycle of five to 7 membered-ring, without minding through a nitrogen atom or an oxygen atom with the nitrogen atom which these combine. this heterocycle top -- a low-grade alkyl group and phenyl -- low-grade -- an alkyl group -- the radical chosen from the group may permute. It is shown. R3 shows a hydrogen atom or a hydroxylation low-grade alkyl group. Moreover, these may become together and R2 and R3 may form an oxo-radical, a low-grade alkylidene radical, a low-grade alkoxy permutation low-grade alkylidene radical, a low-grade alkoxy carbonyl permutation low-grade alkylidene radical, or a phenyl permutation low-grade alkylidene radical. R On a pyridine ring, as a substituent the phenyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, and pyridyl -- a radical -- as a substituent on the pyridyl carbonyl group; 9-oxo-fluorenyl group; quinoline ring which has had the radical chosen from the group quinolyl carbonyl group; which has had the phenyl group -- adamantyl carbonyl group; -- as a substituent on a thiophene ring thienyl carbonyl group; which has had the phenyl group -- thiazolyl carbonyl group; which has had the phenyl group as a substituent on a thiazole ring -- a cycloalkyl carbonyl group or \*\* -- [Formula 10]

(p shows 1 or 2.) R8 shows a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, a hydroxyl group, the amino group that has had the low-grade alkanoyl radical as a substituent, a nitro group, a halogen atom, or a lower alkoxy group. R9 is a radical. -- It is NR ten R11 (R10 shows the low-grade alkanoyl radical which has had the halogen atom as a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, or a substituent.). R11 -- as a low-grade alkyl group and a substituent -- a halogen atom -- and -- a hydroxyl group -- the low-grade alkanoyl radical which has had the radical chosen from the group -- a cycloalkyl radical and phenyl ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and a halogen -- an atom -- the phenyl low-grade alkyl group which it may have the

radical chosen from the group, and has had the hydroxyl group into the low-grade alkyl group part -- The phenoxy low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, On a phenyl ring, as a substituent A low-grade alkyl group, a phenyl group, a lower alkoxy group, A halogen atom permutation low-grade alkyl group, the amino group which has had the low-grade alkyl group as a substituent, a nitro group, the low-grade alkanoyl radical permutation amino group, and a halogen -- an atom -- the phenoxy low-grade alkanoyl radical which it may have the radical chosen from the group, and has had the halogen atom as a substituent in a part for a low-grade alkanoyl base -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and pyridyl low-grade alkyl group and phenyl -- low-grade -- an alkyl group -- the aminocarbonyl radical which has had the radical chosen from the group -- The low-grade alkoxy carbonyl group which has had the halogen atom as a substituent, A low-grade alkoxy permutation low-grade alkanoyl radical, a low-grade alkanoloxo permutation low-grade alkanoyl radical, a phenoxy low-grade alkoxy carbonyl group, a benzofuril carbonyl group, a benzoimidazolyl carbonyl group; quinolyl carbonyl group, a quinolyl oxy-permutation low-grade alkanoyl radical, a phenyl low-grade alkoxy carbonyl group, and \*\* -- [Formula 11]

A tetrahydro iso quinolyl carbonyl group, a benzoyl low-grade alkyl group, a quinoline ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and oxo-one -- a radical -- the tetrahydro quinolyl oxy-permutation low-grade alkanoyl radical which has had the radical chosen from the group -- A low-grade alkyl sulfonyl group, a pyridyl low-grade alkoxy carbonyl group, A fluorenyl low-grade alkoxy carbonyl group, a low-grade alkenyloxy carbonyl group, A tetrahydro naphthyloxy permutation low-grade alkanoyl radical, a phenyl low-grade alkenyl carbonyl group, a piperidine ring top -- as a substituent -- a low-grade alkanoyl radical and a low-grade alkoxy carbonyl group -- and low-grade -- an alkyl group -- the piperidinyl low-grade alkoxy carbonyl group which has had the radical chosen from the group is shown. R10 and R11 [ moreover, ] an iso indoline ring may be formed with the nitrogen atom which these combine. ; hydrogen atom; -- low-grade alkanoloxo radical; -- low-grade alkanoyl radical; -- lower alkoxy group; -- as a substituent on a phenyl ring benzoyl; cycloalkyl radical; which has had the low-grade alkyl group -- low-grade alkyl group; -- low-grade alkylthio group; -- phenyl low-grade alkanoyl radical; which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring -- a phenyl ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group -- A lower alkoxy group, a phenyl lower alkoxy group, a hydroxyl group, a low-grade alkanoloxo radical, A halogen atom permutation lower alkoxy group, a nitro group, the amino group that has had the low-grade alkanoyl radical as a substituent, the amino permutation which has had the low-grade alkyl group as a phenyl group and a substituent -- a lower alkoxy group -- as a substituent on the phenyl group; phenoxy group; phenyl ring which has had the radical chosen from the group On a phenyl ring, The phenoxy low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group; as a substituent phenyl low-grade alkyl group; which has had the low-grade alkyl group -- ANIRINO low-grade alkyl group; which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring -- a phenyl ring top -- as a substituent -- a halogen atom -- In a low-grade alkoxy carbonyl group list, as a substituent as a low-grade alkyl group and a substituent the amino permutation which has had the low-grade alkyl group -- low-grade -- an alkyl group -- the aminocarbonyl which has had the radical chosen from the group -- a radical -- as a substituent on the phenyl lower alkoxy group; phenyl ring which has had the radical chosen from the group On a phenyl ring, The benzoyl lower alkoxy group which has had the halogen atom; as a substituent phenyl low-grade alkenyl radical; which has had the halogen atom -- the benzoyl which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring -- low-grade -- alkyl group; pyrrolidinyl permutation lower alkoxy group; -- a nitrogen atom -- the heterocycle radical (this heterocycle radical -- as a substituent -- a low-grade alkyl group --) of the monocycle of five to 11 membered-ring of the saturation which has an oxygen atom or 1-4 sulfur atoms, or partial saturation, or 2 \*\*\*\* A phenyl group, a low-grade alkanoyl radical, a halogen atom, It considers as an alkylamino carbonyl group; substituent. a phenyl low-grade alkyl group and oxo-one -- a radical -- you may have 1-3 radicals chosen from the group --; cyclo alkenyl radical; phenyl -- low-grade -- The amino sulfonyloxy radical which has had the low-grade alkyl group; cyano group; or radical-(A) m-CHR 12R13 (A is the same as the above.) R12 shows a hydrogen atom, a hydroxyl group, or a low-grade alkanoloxo

radical. R13 shows the phenyl low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on the phenyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, or a phenyl ring. m shows 0 or 1. It is shown. . X shows methylene group, single bond, and radical =CH- or radical-NR14- (R14 shows a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, or a low-grade alkanoyl radical.). Y shows -NRA- (RA shows hydrogen atom, low-grade alkoxy carbonyl permutation low-grade alkyl group, carboxy permutation low-grade alkyl group, or radical-ACONRBRC.). RB and RC are the same here — or it differs and a hydrogen atom or a low-grade alkyl group is shown. Moreover, without minding through a nitrogen atom or an oxygen atom with the nitrogen atom which these combine, it may join together mutually and this RB and RC may form the saturation heterocycle of five to 7 membered-ring. The low-grade alkyl group may permute on this heterocycle. It is shown. R2 [ however, ] -- radical-NR four R5 (R4 and R5 are the same -- or it differs and a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, or benzoyl is shown.), a hydrogen atom, a hydroxyl group, a low-grade alkoxy carbonyl group permutation lower alkoxy group, a carboxy group permutation lower alkoxy group, a lower alkoxy group, a low-grade alkanoloxo radical permutation low-grade alkyl group, and radical-(O) m-A-(CO) uNR six R7 (m shows 1 and u shows 0 or 1.) R6 and R7 [ the same or ] [ whether it differs and a hydrogen atom or a low-grade alkyl group is shown and ] Form the saturation heterocycle of five to 6 membered-ring, without R6 and R7 minding through a nitrogen atom or an oxygen atom with the nitrogen atom which these combine (the low-grade alkyl group may permute on this heterocycle). or;R in which amino permutation low-grade alkanoloxo radical; which has had the low-grade alkyl group as a substituent, or R2 and R3 become together, and they form an oxo-radical or a low-grade alkylidene radical -- \*\* -- [Formula 12]

When it comes out, and it is and R8 shows a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, a hydroxyl group, a halogen atom, a lower alkoxy group, or the amino group, respectively, R9 must not be a hydrogen atom and R9 is a radical. - It is NR ten R11. R11 Low-grade alkanoyl radical, a phenyl low-grade alkoxy carbonyl group or phenyl ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group, the amino group, and the low-grade alkanoyl radical permutation amino group -- and -- a lower alkoxy group -- don't be the phenoxy low-grade alkanoyl radical which has had 1-3 radicals chosen from the group. Moreover, R1 must not be the phenyl group which R9 has had the hydroxyl group, the low-grade alkyl group, the lower alkoxy group, or the low-grade alkanoloxo radical as a substituent on a phenyl ring, when R2 is a hydrogen atom, the amino group, a mono-low-grade alkylamino radical, or a JI low-grade alkylamino radical in a hydrogen atom, or R2 and R3 become together and they form an oxo-radical. R9 [ moreover, ] -- \*\* -- [Formula 13]

(n shows 1 or 2) and G -- \*\* -- [Formula 14]

When (R2 and R3 are the same as the above) is shown, X must not be methylene group or radical =CH-. When one side of R10 and R11 is furthermore a hydrogen atom, another side must not be a low-grade alkyl group. ] The remedy constituent for vasopressin antagonism containing at least one sort which came out and was chosen from the benzoheterocycle derivative expressed and its salt.

[Claim 3] The remedy constituent for oxytocin antagonism containing at least one sort chosen from a benzoheterocycle derivative and its salt according to claim 2.

[Claim 4] General formula [\*\* 15]

The inside G of [type is [Formula 16].

\*\*\*\*\*. R1 -- as a hydrogen atom, a halogen atom, a low-grade alkyl group, a lower alkoxy group, a hydroxyl group, a low-grade alkanoloxo radical, and a substituent -- a low-grade alkyl group and low-grade alkanoyl -- a radical -- the aminocarbonyl lower alkoxy group which has had the low-grade alkyl group as the amino lower alkoxy group which has had the radical chosen from the group, the amino group which has had the low-grade alkyl group as a substituent, a carboxy permutation lower alkoxy group, a low-grade alkoxy carbonyl permutation lower alkoxy group, or a substituent is shown. R2 -- radical-NR four R5 (R4 and R5 are the same -- or -- differing -- a hydrogen atom --) the benzoyl which has had the halogen atom as a substituent on the low-grade alkyl group which has had the hydroxyl group as a substituent, or a phenyl ring is shown. ; hydrogen atom; -- hydroxyl-group; -- lower alkoxy group; -- carboxy permutation

low-grade alkyl group; -- cyano permutation low-grade alkyl group; -- tetrazolyl group permutation low-grade alkyl group; -- low-grade alkanoloxyl radical permutation low-grade alkyl group; -- a low-grade alkoxy carbonyl permutation -- low-grade -- as an alkyl group; substituent A low-grade alkyl group amino permutation low-grade alkanoloxyl radical; which has had -- low-grade alkoxy carbonyl group permutation lower alkoxy group; -- carboxy group permutation lower alkoxy group; -- low-grade alkanoyl radical; or radical-(O) m-A-(CO) uNR six R7 (m and u show 0 or 1, respectively.) However, m and u must not be 0 simultaneously. A shows a low-grade alkylene group. It differs and R6 and R7 show the same or the phenyl group which has had the halogen atom on the amino permutation low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a hydrogen atom, a lower alkoxy group, a low-grade alkyl group, and a substituent, a carbamoyl group permutation low-grade alkyl group, an adamantyl radical permutation low-grade alkyl group, a low-grade alkyl sulfonyl group, or a phenyl ring. R6 and R7 may form the saturation heterocycle of five to 7 membered-ring, without minding through a nitrogen atom or an oxygen atom with the nitrogen atom which these combine. this heterocycle top -- a low-grade alkyl group and phenyl -- low-grade -- an alkyl group -- the radical chosen from the group may permute. It is shown. R3 shows a hydrogen atom or a hydroxylation low-grade alkyl group. Moreover, these may become together and R2 and R3 may form an oxo-radical, a low-grade alkylidene radical, a low-grade alkoxy permutation low-grade alkylidene radical, a low-grade alkoxy carbonyl permutation low-grade alkylidene radical, or a phenyl permutation low-grade alkylidene radical. R On a pyridine ring, as a substituent the phenyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, and pyridyl -- a radical -- as a substituent on the pyridyl carbonyl group; 9-oxo-fluorenyl group; quinoline ring which has had the radical chosen from the group quinolyl carbonyl group; which has had the phenyl group -- adamantyl carbonyl group; -- as a substituent on a thiophene ring thienyl carbonyl group; which has had the phenyl group -- thiazolyl carbonyl group; which has had the phenyl group as a substituent on a thiazole ring -- a cycloalkyl carbonyl group or \*\* -- [Formula 17]

(p shows 1 or 2.) R8 shows a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, a hydroxyl group, the amino group that has had the low-grade alkanoyl radical as a substituent, a nitro group, a halogen atom, or a lower alkoxy group. R9 is a radical. -- It is NR ten R11 (R10 shows the low-grade alkanoyl radical which has had the halogen atom as a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, or a substituent.). R11 -- as a low-grade alkyl group and a substituent -- a halogen atom -- and -- a hydroxyl group -- the low-grade alkanoyl radical which has had the radical chosen from the group -- a cycloalkyl radical and phenyl ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and a halogen -- an atom -- the phenyl low-grade alkyl group which it may have the radical chosen from the group, and has had the hydroxyl group into the low-grade alkyl group part -- The phenoxy low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, On a phenyl ring, as a substituent A low-grade alkyl group, a phenyl group, a lower alkoxy group, A halogen atom permutation low-grade alkyl group, the amino group which has had the low-grade alkyl group as a substituent, a nitro group, the low-grade alkanoyl radical permutation amino group, and a halogen -- an atom -- the phenoxy low-grade alkanoyl radical which it may have the radical chosen from the group, and has had the halogen atom as a substituent in a part for a low-grade alkanoyl base -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and pyridyl low-grade alkyl group and phenyl -- low-grade -- an alkyl group -- the aminocarbonyl radical which has had the radical chosen from the group -- The low-grade alkoxy carbonyl group which has had the halogen atom as a substituent, A low-grade alkoxy permutation low-grade alkanoyl radical, a low-grade alkanoloxyl permutation low-grade alkanoyl radical, a phenoxy low-grade alkoxy carbonyl group, a benzofuril carbonyl group, a benzoimidazolyl carbonyl group; quinolyl carbonyl group, a quinolyl oxy-permutation low-grade alkanoyl radical, a phenyl low-grade alkoxy carbonyl group, and \*\* -- [Formula 18]

A tetrahydro iso quinolyl carbonyl group, a benzoyl low-grade alkyl group, a quinoline ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group and oxo-one -- a radical -- the tetrahydro quinolyl oxy-permutation low-grade alkanoyl radical which has had the radical chosen from the group -- A low-grade alkyl sulfonyl group, a pyridyl low-grade alkoxy carbonyl group, A fluorenyl low-

grade alkoxy carbonyl group, a low-grade alkenyloxy carbonyl group, A tetrahydro naphthyloxy permutation low-grade alkanoyl radical, a phenyl low-grade alkenyl carbonyl group, a piperidine ring top -- as a substituent -- a low-grade alkanoyl radical and a low-grade alkoxy carbonyl group -- and low-grade -- an alkyl group -- the piperidinyl low-grade alkoxy carbonyl group which has had the radical chosen from the group is shown. R10 and R11 [ moreover, ] an iso indoline ring may be formed with the nitrogen atom which these combine. ; hydrogen atom; -- low-grade alkanoloxo radical; -- low-grade alkanoyl radical; -- lower alkoxy group; -- as a substituent on a phenyl ring benzoyl; cycloalkyl radical; which has had the low-grade alkyl group -- low-grade alkyl group; -- low-grade alkylthio group; -- phenyl low-grade alkanoyl radical; which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring -- a phenyl ring top -- as a substituent -- a low-grade alkyl group -- A lower alkoxy group, a phenyl lower alkoxy group, a hydroxyl group, a low-grade alkanoloxo radical, A halogen atom permutation lower alkoxy group, a nitro group, the amino group that has had the low-grade alkanoyl radical as a substituent, the amino permutation which has had the low-grade alkyl group as a phenyl group and a substituent -- a lower alkoxy group -- as a substituent on the phenyl group; phenoxy group; phenyl ring which has had the radical chosen from the group On a phenyl ring, The phenoxy low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group; as a substituent phenyl low-grade alkyl group; which has had the low-grade alkyl group -- ANIRINO low-grade alkyl group; which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring -- a phenyl ring top -- as a substituent -- a halogen atom -- In a low-grade alkoxy carbonyl group list, as a substituent as a low-grade alkyl group and a substituent the amino permutation which has had the low-grade alkyl group -- low-grade -- an alkyl group -- the aminocarbonyl which has had the radical chosen from the group -- a radical -- as a substituent on the phenyl lower alkoxy group; phenyl ring which has had the radical chosen from the group On a phenyl ring, The benzoyl lower alkoxy group which has had the halogen atom; as a substituent phenyl low-grade alkenyl radical; which has had the halogen atom -- the benzoyl which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring -- low-grade -- alkyl group; pyrrolidinyl permutation lower alkoxy group; -- a nitrogen atom -- the heterocycle radical (this heterocycle radical -- as a substituent -- a low-grade alkyl group --) of the monocycle of five to 11 membered-ring of the saturation which has an oxygen atom or 1-4 sulfur atoms, or partial saturation, or 2 \*\*\*\* A phenyl group, a low-grade alkanoyl radical, a halogen atom, It considers as an alkylamino carbonyl group; substituent. a phenyl low-grade alkyl group and oxo-one -- a radical -- you may have 1-3 radicals chosen from the group --; cyclo alkenyl radical; phenyl -- low-grade -- The amino sulfonyloxy radical which has had the low-grade alkyl group; cyano group; or radical-(A) m-CHR 12R13 (A is the same as the above.) R12 shows a hydrogen atom, a hydroxyl group, or a low-grade alkanoloxo radical. R13 shows the phenyl low-grade alkyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on the phenyl group which has had the low-grade alkyl group as a substituent on a phenyl ring, or a phenyl ring. m shows 0 or 1. It is shown. X shows methylene group, single bond, and radical =CH- or radical-NR14- (R14 shows a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, or a low-grade alkanoyl radical.). Y shows -NRA- (RA shows hydrogen atom, low-grade alkoxy carbonyl permutation low-grade alkyl group, carboxy permutation low-grade alkyl group, or radical-ACONRBRC.). RB and RC are the same here -- or it differs and a hydrogen atom or a low-grade alkyl group is shown. Moreover, without minding through a nitrogen atom or an oxygen atom with the nitrogen atom which these combine, it may join together mutually and this RB and RC may form the saturation heterocycle of five to 7 membered-ring. The low-grade alkyl group may permute on this heterocycle. It is shown. ] The remedy constituent for vasopressin \*\*\*\* containing at least one sort which came out and was chosen from the benzoheterocycle derivative expressed and its salt.

---

[Translation done.]

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平9-221476

(43) 公開日 平成9年(1997)8月26日

(51) Int.Cl. <sup>6</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 223/16			C 0 7 D 223/16	A
A 6 1 K 31/55	ABU		A 6 1 K 31/55	ABU
	AED			AED
C 0 7 D 243/12			C 0 7 D 243/12	
243/14			243/14	
審査請求 未請求 請求項の数 4 F D (全 646 頁) 最終頁に続く				

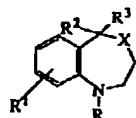
(21) 出願番号	特願平8-354761	(71) 出願人	000206956 大塚製薬株式会社 東京都千代田区神田司町2丁目9番地
(22) 出願日	平成8年(1996)12月16日	(72) 発明者	小川 英則 徳島県板野郡松茂町中喜来字中瀬西ノ越25番地の18
(31) 優先権主張番号	特願平7-348123	(72) 発明者	近藤 一見 徳島県板野郡松茂町中喜来字稲本55番地の11
(32) 優先日	平7(1995)12月15日	(72) 発明者	山下 博司 東京都文京区湯島4丁目5-11 堀内ビル202号
(33) 優先権主張国	日本 (J P)	(74) 代理人	弁理士 三枝 英二 (外4名) 最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 医薬組成物

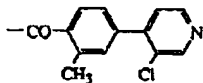
(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 本発明は、バソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤、バソプレシン作動剤等として有用な医薬組成物を提供することを目的とする。

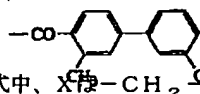
【解決手段】 本発明の医薬組成物中に含有されるベンゾヘテロ環誘導体は、一般式(1)で代表される化合物である。



(1)



(2)



(3)

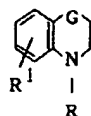
【式中、Xは-CH<sub>2</sub>-, -NR<sup>14</sup> (R<sup>14</sup>: 水素原子、低級アルキル基等) または単結合を示

し、R<sup>1</sup>は水素原子、ハロゲン原子等を示し、R<sup>2</sup>は水素原子等を示し、R<sup>3</sup>は水素原子、-CH<sub>2</sub>COOR<sup>15</sup> (R<sup>15</sup>: 水素、低級アルキル基等) 等を示し、Rは式(2)、式(3)等の基を示す]

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式

【化1】



【式中Gは

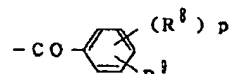
【化2】

$\begin{matrix} R^2 & R^3 \\ \diagdown & \diagup \\ X & Y \\ \diagup & \diagdown \\ R^2 & R^3 \end{matrix}$

を示す。R<sup>1</sup>は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。R<sup>2</sup>は、基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>（R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。）；水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基；カルボキシ基置換低級アルコキシ基；低級アルカノイル基；又は基-(O)m-A-(CO)uNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>（m及びuはそれぞれ0又は1を示す。但しm及びuは同時に0であってはならない。Aは低級アルキレン基を示す。R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。）を示す。R<sup>3</sup>は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。またR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級

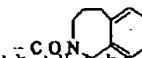
アルキリデン基を形成してもよい。Rは、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基；シクロアルキルカルボニル基又は基

【化3】



（pは1又は2を示す。R<sup>8</sup>は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R<sup>9</sup>は、基-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>（R<sup>10</sup>は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R<sup>11</sup>は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基；キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基

【化4】



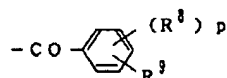
、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、ベンゾイル



低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリンオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。また $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。)；水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；シクロアルキル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい）；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有する

ことのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基—(A)— $m-CHR^{12}R^{13}$ （Aは前記に同じ。 $R^{12}$ は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。 $R^{13}$ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。 $m$ は0又は1を示す。）を示す。Xはメチレン基、単結合、基— $CH-$ 又は基— $NR^{14}-$ （ $R^{14}$ は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。）を示す。Yは— $NR^A-$ を示す（ $R^A$ は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基— $ACONR^BR^C$ を示す。ここで $R^B$ 及び $R^C$ は、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこの $R^B$ 及び $R^C$ は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。）を示す。但し、 $R^2$ が基— $NR^4R^5$ （ $R^4$ 及び $R^5$ が同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。）、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基—(O)— $m-A-(CO)uNR^6R^7$ （ $m$ は1、 $u$ は0又は1を示す。 $R^6$ 及び $R^7$ が同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示すか、 $R^6$ 及び $R^7$ がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～6員環の飽和複素環を形成する（該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい））、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；又は $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する；Rが基

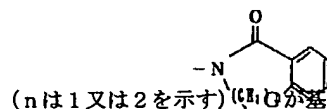
【化5】



であって、 $R^8$ が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、 $R^9$ は水素原子であってはならないし、また $R^9$ が基— $NR^{10}R^{11}$ であって且つ $R^{11}$ が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であってはならない。また $R^1$ が水素原子で、 $R^2$ が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミノ基であるか、或いは $R^2$ と $R^3$ とが一緒になってオキシ基を形成するとき、 $R^9$ はフェニル環上に置換基として水酸基、低級ア

ルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはいない。またR<sup>9</sup>が基

【化6】

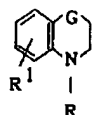


【化7】

(R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は前記に同じ)を示すとき、Xはメチレン基又は基=CH-であってはいない。またR<sup>10</sup>及びR<sup>11</sup>は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはいない。またR<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が同時に水素原子を示すとき、Rは無置換のピリジルカルボニル基、無置換のチエニルカルボニル基、無置換のチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基であってはいない。更にR<sup>3</sup>が水素原子、R<sup>2</sup>が水素原子、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ基、基-(O)m-A-(CO)uNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (mが1、uが0又は1を示す。R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)又は基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)を示すか、又はR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を示すとき、R<sup>9</sup>は基-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> (R<sup>10</sup>は低級アルキル基、R<sup>11</sup>は低級アルキル基を示す。)、水素原子、低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基又は低級アルキル基であってはいない。)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有する医薬組成物。

【請求項2】 一般式

【化8】



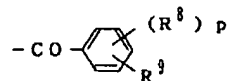
【式中Gは

【化9】

を示す。R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>は、水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又

は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。R<sup>2</sup>は、基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。); 水素原子; 水酸基; 低級アルコキシ基; カルボキシ置換低級アルキル基; シアノ置換低級アルキル基; テトラゾリル基置換低級アルキル基; 低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基; 低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基; 置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基; 低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基; カルボキシ基置換低級アルコキシ基; 低級アルカノイル基; 又は基-(O)m-A-(CO)uNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m及びuはそれぞれ0又は1を示す。但しm及びuは同時に0であってはいない。Aは低級アルキレン基を示す。R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5〜7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)を示す。R<sup>3</sup>は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。またR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。Rは、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基; 9-オキシフルオレニル基; キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基; アダマンチルカルボニル基; チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基; チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基; シクロアルキルカルボニル基又は基

【化10】



(pは1又は2を示す。R<sup>8</sup>は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低

級アルコキシ基を示す。R<sup>9</sup>は、基-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> (R<sup>10</sup>は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R<sup>11</sup>は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基；キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基

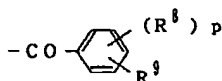
#### 【化11】

、テトラヒドロイソキノリンカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。またR<sup>10</sup>及びR<sup>11</sup>は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。)；水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；シクロアルキル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのある

フェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい)；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基-(A)m-CHR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> (Aは前記に同じ。R<sup>12</sup>は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R<sup>13</sup>はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。)を示す。Xはメチレン基、単結合、基=CH-又は基-NR<sup>14</sup>- (R<sup>14</sup>は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。Yは-NR<sup>A</sup>-を示す (R<sup>A</sup>は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基-ACONR<sup>B</sup>R<sup>C</sup>を示す。ここでR<sup>B</sup>及びR<sup>C</sup>は、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこのR<sup>B</sup>及びR<sup>C</sup>は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す

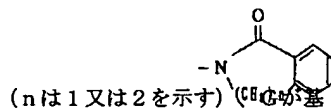
す。但し、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ が同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。)、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基 $-(O)m-A-(CO)uNR^6R^7$  ( $m$ は1、 $u$ は0又は1を示す。 $R^6$ 及び $R^7$ が同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示すか、 $R^6$ 及び $R^7$ がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5~6員環の飽和複素環を形成する (該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい) )、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；又は $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する； $R$ が基

【化12】



であって、 $R^8$ が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、 $R^9$ は水素原子であってはならないし、また $R^9$ が基 $-NR^{10}R^{11}$ であって且つ $R^{11}$ が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であってはならない。また $R^1$ が水素原子で、 $R^2$ が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミノ基であるか、或いは $R^2$ と $R^3$ とが一緒になってオキシ基を形成するとき、 $R^9$ はフェニル環上に置換基として水酸基、低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはならない。また $R^9$ が基

【化13】



【化14】

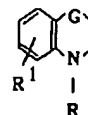
( $R^2$ 及び $R^3$ は前記に同じ)  $X$ を示すとき、 $X$ はメチレン基又は基 $=CH-$ であってはならない。更に $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはならない。) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有するパゾプレシン拮抗用医薬組成物。

【請求項3】 請求項2に記載のベンゾヘテロ環誘導体

及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有するオキシトシン拮抗用医薬組成物。

【請求項4】 一般式

【化15】



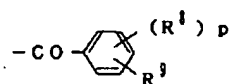
【式中Gは

【化16】

を示す。 $R^1$ は水素原子、又は水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。 $R^2$ は、基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。); 水素原子; 水酸基; 低級アルコキシ基; カルボキシ置換低級アルキル基; シアノ置換低級アルキル基; テトラゾリル基置換低級アルキル基; 低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基; 低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基; 置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基; 低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基; カルボキシ基置換低級アルコキシ基; 低級アルカノイル基; 又は基 $-(O)m-A-(CO)uNR^6R^7$  ( $m$ 及び $u$ はそれぞれ0又は1を示す。但し $m$ 及び $u$ は同時に0であってはならない。 $A$ は低級アルキレン基を示す。 $R^6$ 及び $R^7$ は同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。 $R^6$ 及び $R^7$ は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5~7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)を示す。 $R^3$ は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。また $R^2$ と $R^3$ とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカル

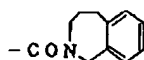
ボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。Rは、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基；シクロアルキルカルボニル基又は基

【化17】



(pは1又は2を示す。R<sup>8</sup>は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R<sup>9</sup>は、基-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> (R<sup>10</sup>は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R<sup>11</sup>は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基；キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基

【化18】



、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。またR<sup>10</sup>及びR<sup>11</sup>は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。)；水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；シクロアルキル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい)；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミ

ノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基—(A)m—CHR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>（Aは前記に同じ。R<sup>12</sup>は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R<sup>13</sup>はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。）を示す。）Xはメチレン基、単結合、基=CH—又は基—NR<sup>14</sup>—（R<sup>14</sup>は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。）を示す。Yは—NR<sup>A</sup>—を示す

（R<sup>A</sup>は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基—ACONR<sup>B</sup>R<sup>C</sup>を示す。ここでR<sup>B</sup>及びR<sup>C</sup>は、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこのR<sup>B</sup>及びR<sup>C</sup>は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。）を示す。）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有するバソプレシン作用薬組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、ベンゾヘテロ環誘導体を含有する医薬組成物に関する。

【0002】

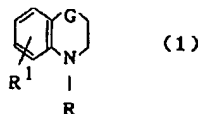
【発明が解決しようとする課題】本発明は、バソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤、バソプレシン作用薬等として有用な医薬組成物を提供することを課題とする。

【0003】

【課題を解決するための手段】本発明の医薬組成物中に含有されるベンゾヘテロ環誘導体は、下記一般式（1）で表わされる。

【0004】

【化19】



【0005】〔式中Gは

【0006】

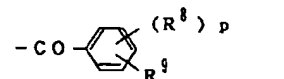
【化20】

【0007】をXとする。R<sup>1</sup>は水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル

ル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。R<sup>2</sup>は、基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>（R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。）；水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルコキシ基；低級アルカノイル基；又は基—(O)m—A—(CO)uNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>（m及びuはそれぞれ0又は1を示す。但しm及びuは同時に0であってはならない。Aは低級アルキレン基を示す。R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。）を示す。R<sup>3</sup>は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。またR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。Rは、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレン基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基；シクロアルキルカルボニル基又は基

【0008】

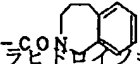
【化21】



【0009】(pは1又は2を示す。R<sup>8</sup>は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R<sup>9</sup>は、基-N R<sup>10</sup>R<sup>11</sup>(R<sup>10</sup>は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R<sup>11</sup>は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基；キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基

【0010】

【化22】

【0011】、, テトラヒドロキノリルカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。またR<sup>10</sup>及びR<sup>11</sup>は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。)；水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アル

ルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；シクロアルキル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい)；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基-(A)m-CHR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>(Aは前記に同じ。R<sup>12</sup>は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R<sup>13</sup>はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。)を示す。Xはメチレン基、単結合、基=CH-又は基-NR<sup>14</sup>- (R<sup>14</sup>は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。Yは-NR<sup>A</sup>-を示す(R<sup>A</sup>は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基-ACONR<sup>B</sup>R<sup>C</sup>を示す。ここでR<sup>B</sup>及びR<sup>C</sup>は、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこ

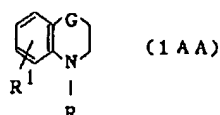
の $R^B$ 及び $R^C$ は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す。

【0012】本発明者らの研究によれば、上記一般式(1)のベンゾヘテロ環誘導体及びその塩は、優れたパソプレシン拮抗作用、オキシトシン拮抗作用及びパソプレシン作働作用を有することが見出された。

【0013】上記一般式(1)において、下記一般式(1AA)で表されるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩は、文献未記載の新規化合物である。

【0014】

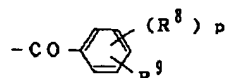
【化23】



【0015】〔式中G、 $R^1$ 及びRは前記に同じ。但し、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ が同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。)、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基 $-(O)m-A-(CO)uN R^6R^7$  ( $m$ は1、 $u$ は0又は1を示す。 $R^6$ 及び $R^7$ が同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示すか、 $R^6$ 及び $R^7$ がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～6員環の飽和複素環を形成する(該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい))、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；又は $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する；Rが基

【0016】

【化24】

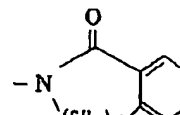


【0017】であって、 $R^8$ が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、 $R^9$ は水素原子であってはいならないし、また $R^9$ が基 $-NR^{10}R^{11}$ であって且つ $R^{11}$ が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であってはいならない。また $R^1$ が水素原子で、 $R^2$ が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミ

ノ基であるか、或いは $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成するとき、 $R^9$ はフェニル環上に置換基として水酸基、低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはいならない。また $R^9$ が基

【0018】

【化25】



【0019】( $n$ は1又は2を示す)、Gが基

【0020】

【化26】



【0021】( $R^2$ 及び $R^3$ は前記に同じ)を示すとき、Xはメチレン基又は基 $=CH-$ であってはいならない。また $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはいならない。また $R^1$ 及び $R^2$ が同時に水素原子を示すとき、Rは無置換のピリジルカルボニル基、無置換のチエニルカルボニル基、無置換のチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基であってはいならない。また $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ が水素原子、Gが基

【0022】

【化27】



【0023】( $R^2$ 及び $R^3$ は前記に同じ)、Xが単結合を示すとき、Rは無置換のキノリルカルボニル基であってはいならない。更に $R^3$ が水素原子、 $R^2$ が水素原子、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ基、基 $-(O)m-A-(CO)uNR^6R^7$  ( $m$ が1、 $u$ が0又は1を示す。 $R^6$ 及び $R^7$ は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)又は基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)を示すか、又は $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を示すとき、 $R^9$ は基 $-NR^{10}R^{11}$  ( $R^{10}$ は低級アルキル基、 $R^{11}$ は低級アルキル基を示す。)、水素原子、低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基又は低級アルキル基であってはいならない。]

本発明のパソプレシン拮抗用医薬組成物は、例えば血管拡張作用、血圧降下作用、肝糖放出抑制作用、メサングウム細胞増殖抑制作用、水利尿作用、血小板凝集抑制作用、嘔吐抑制作用、尿素排泄促進作用、第VIII因子分泌



抑制作用、心機能亢進作用、メサングウム細胞収縮抑制作用、肝糖新生抑制作用、アルドステロン分泌抑制作用、エンドセリン産生抑制作用、レニン分泌調節作用、記憶調節作用、体温調節作用、プロスタグランジン産生調節作用等を有し、血管拡張剤、降圧剤、水利尿剤、血小板凝集抑制剤、尿素排泄促進剤、抗心不全剤、抗腎不全剤等として有用であり、高血圧、浮腫、腹水、心不全、腎機能障害、バソプレシン分泌異常症候群（SIA DH）、肝硬変、低ナトリウム血症、低カリウム血症、糖尿病、循環不全、動揺病、水代謝障害、腎不全、各種虚血性疾患等の予防及び治療に有効である。更に本発明の化合物は、副作用が少なく、薬効の持続時間が長いという特徴を有している。

【0024】本発明のオキシトシン拮抗用医薬組成物は、例えば子宮平滑筋収縮抑制作用、乳汁放出抑制作用、プロスタグランジン合成及び放出抑制作用、血管拡張作用を有し、オキシトシン関連疾患、特に早期分娩、帝王切開前の出産の阻止、月経困難等の予防乃至治療に有効である。

【0025】本発明のバソプレシン作働用医薬組成物は、様々な排尿障害、大量尿又は出血状態に有用であり、頻尿、尿崩症、尿失禁、遺尿症特に夜尿症、自然発生性出血、血友病、von Willebrand病、尿毒症、先天的又は後天的血小板機能障害、外傷性及び手術時出血、肝硬変等の診断、予防乃至治療に有効である。

【0026】

【発明の実施の形態】本発明の一般式（1）のベンゾヘテロ環誘導体には、下記の種々の態様の化合物が含まれる。

【0027】（1）Gが基-C（R<sup>2</sup>）（R<sup>3</sup>）-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式（1）における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>（R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式（1）における定義に同じ。）を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rがピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジカルボニル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（2）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（3）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（4）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（5）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（6）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（7）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（8）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（9）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（10）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0028】（11）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（12）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（13）Gが基-C（R<sup>2</sup>）（R<sup>3</sup>）-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式（1）における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>（R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式（1）における定義に同じ。）を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基（R<sup>9</sup>及びpは前記一般式（1）における定義に同じ。R<sup>9</sup>は水素原子を示す。）である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（14）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（13）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（15）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（13）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（16）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（13）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基で

ある前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(17) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(13)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(18) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(13)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(19) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(13)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(20) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(13)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0029】(21) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(13)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(22) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(13)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(23) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(13)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(24) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(13)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(25) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(26) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(27) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(28) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(29) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(30) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0030】(31) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(32) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(33) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(34) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(35) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(36) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(25)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(37) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(38) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(37)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(39) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(37)の定義

に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(40)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0031】(41)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(42)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(43)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(44)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(45)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(46)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(47)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(48)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(37)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(49)  $G$ が基- $C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 $X$ がメチレン基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基- $NR^4R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R$ が前記【化5】で示される基( $R^9$ 及び $p$ は前記一般式

(1)における定義に同じ。 $R^8$ はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(50)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)

で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0032】(51)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(52)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(53)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(54)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(55)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(56)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(57)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(58)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(59)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(60)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(49)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0033】(61)  $G$ が基- $C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 $X$ がメチレン基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基- $NR^4R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R$ が前記【化5】で示される基( $R^9$ 及び $p$ は前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わさ

れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(62) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(63) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(64) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(65) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(66) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(67) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(68) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(69) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(70) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0034】(71) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(72) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(73) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xがメチレン基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-N $R^4$  $R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前

記【化5】で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。 $R^8$ は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(74) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(75) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(76) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(77) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(78) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(79) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(80) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0035】(81) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(82) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(83) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(84) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(85) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが基-N $R^{14}$ -( $R^{14}$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義

に同じであり、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R$ がピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(86)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(87)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(88)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(89)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(90)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0036】(91)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(92)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(93)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(94)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(95)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(96)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(85)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされる

ベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(97)  $G$ が基 $-C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 $X$ が基 $-NR^{14}-$  ( $R^{14}$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R$ が前記【化5】で示される基 ( $R^9$ 及び $p$ は前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(98)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(99)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(100)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0037】(101)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(102)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(103)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(104)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(105)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(106)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(107)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(108) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(97)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(109) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが基-N $R^{14}$ -( $R^{14}$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-N $R^4R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基( $R^6$ は及びp前記一般式

(1)における定義に同じ。 $R^8$ は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(110) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0038】(111) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(112) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(113) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(114) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(115) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(116) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(117) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(118) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(119) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(109)の定義

に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(120) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0039】(121) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが基-N $R^{14}$ -( $R^{14}$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^1$ が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-N $R^4R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基( $R^6$ 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(122) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(123) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(124) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(125) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(126) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(127) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(128) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(129) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(130) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ

置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0040】(131) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(121)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(132) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(121)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(133) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが基-NR<sup>14</sup>- (R<sup>14</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(134) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(135) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(136) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(137) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(138) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(139) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(140) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0041】(141) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低

級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(142) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(143) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(144) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(133)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(145) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが基-NR<sup>14</sup>- (R<sup>14</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(146) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(147) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(148) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(149) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(150) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0042】(151) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(152) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導

体又はその塩

(153) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(154) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(155) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(156) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(145)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(157) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが基-NR<sup>4</sup>- (R<sup>4</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(158) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(159) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(160) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0043】(161) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(162) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(163) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(164) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(165) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(166) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(167) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(168) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(157)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(169) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが9-オキソフルオレンル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(170) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0044】(171) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(172) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(173) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(174) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(175) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩



(176) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(177) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(178) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(179) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(180) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0045】(181) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが基-NR<sup>14</sup>- (R<sup>14</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式

(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが9-オキシフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(182) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(183) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(184) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(185) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(186) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(187) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前

記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(188) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(189) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(190) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(191) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(192) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(193) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(194) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(195) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(196) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(197) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(198) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(199) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-(O)m-A-(CO)uNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩



(236)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(73)の定

(248) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(85)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)<sub>m</sub>—A—(CO)<sub>u</sub>





ロ環誘導体又はその塩

(297) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(169)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)uNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(298) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(299) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(300) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(301) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

【0056】(301) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(302) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(303) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(304) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(181)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)uNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(305) Gが基—C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びPは前記一般式(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(306) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(307) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(308) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(309) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(310) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(308) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(309) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(310) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

【0057】(311) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(312) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(313) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(314) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(315) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(316) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(317) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(318) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(319) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(320) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0058】(321) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(322) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(323) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(305)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(324) Gが基—C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(325) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(326) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(327) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(328) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(329) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(330) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0059】(331) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオ

キシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(332) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(333) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(334) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(335) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(336) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(337) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(338) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(339) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(340) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0060】(341) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(342) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(324)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(343) Gが基—C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における

定義に同じであり、 $R^2$ が基- $NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R$ がアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(344)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(345)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(346)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(347)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(348)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(349)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(350)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0061】(351)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(352)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(353)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(354)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(355)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

の塩

(356)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(357)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(358)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(359)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(360)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0062】(361)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(343)の定義に同じであり、 $R^2$ が基-(O)  $m$ -A-(CO)  $u$ - $NR^6R^7$  ( $m$ 、 $u$ 、 $A$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(362)  $G$ が基-C ( $R^2$ ) ( $R^3$ )- $X$ を示し、 $X$ がメチレン基を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基- $NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R$ がチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(363)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(364)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(365)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(366)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(367)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(362)の



定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(368) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(369) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(370) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0063】(371) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(372) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(373) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(374) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(375) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(376) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(377) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(378) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(379) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(362)の

定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(380) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0064】(381) Gが基—C( $R^2$ )( $R^3$ )—X—を示し、Xがメチレン基を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(382) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(383) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(384) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(385) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(386) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(387) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(388) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(389) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(390) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ

置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0065】(391) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(392) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(393) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(394) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(395) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(396) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(397) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(398) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(399) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(381)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(400) Gが基—C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0066】(401) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

はその塩

(402) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(403) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(404) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(405) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(406) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(407) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(408) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(409) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(410) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0067】(411) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(412) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(413) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(400)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(414) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(415) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(416) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(417) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(418) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 $R^2$ が基-(O)m-A-(CO)u-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(419) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが基-NR<sup>14</sup>-( $R^{14}$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)基を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1)における定義に同じ。 $R^8$ は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(420) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0068】(421) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(422) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(423) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(424) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ

基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(425) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(426) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(427) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(428) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(429) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(430) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0069】(431) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(432) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(433) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(434) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(435) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(436) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(437) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(419)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(438) Gが基—C( $R^2$ )( $R^3$ )—X—を示し、Xが基—NR<sup>14</sup>—を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ 及び $R^{14}$ が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(439) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(440) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0070】(441) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(442) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(443) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(444) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(445) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(446) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(447) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(448) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(438)の定義

に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(449) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(450) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0071】(451) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(452) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(453) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(454) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(455) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(456) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(438)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(457) Gが基—C( $R^2$ )( $R^3$ )—X—を示し、Xが基—NR<sup>14</sup>—を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ 及び $R^{14}$ が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(458) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(459) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(460) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0072】(461) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(462) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(463) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(464) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(465) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(466) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(467) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(468) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(469) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(470) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0073】(471) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(472) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の

定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(473) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(474) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(475) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(457)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(476) Gが基—C( $R^2$ )( $R^3$ )—X—を示し、Xが基—NR<sup>14</sup>—を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ 及び $R^{14}$ が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(477) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(478) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(479) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(480) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0074】(481) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(482) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(483) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(484) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(485) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(486) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(487) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(488) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(489) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(490) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0075】(491) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(492) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(493) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(494) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)— $m$ —A—(CO)— $u$ — $NR^6R^7$  ( $m$ 、 $u$ 、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(495) Gが基—C( $R^2$ )( $R^3$ )—X—を示し、Xが基— $NR^{14}$ —を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ 及び $R^{14}$ が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基— $NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(496) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(497) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(498) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(499) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(500) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0076】(501) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(502) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(503) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(504) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(505) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(506) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(507) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(495)の

定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(508)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(509)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(510)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0077】(511)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(512)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(513)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(495)の定義に同じであり、 $R^2$ が基 $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$ ( $m$ 、 $u$ 、 $A$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(514)  $G$ が基 $-C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 $X$ が基 $-NR^{14}-$ を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ 及び $R^{14}$ が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R$ がシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(515)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(516)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(517)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(518)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(519)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(520)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0078】(521)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(522)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(523)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(524)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(525)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(526)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(527)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(528)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(529)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(530)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(514)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0079】(531)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記

(514) の定義に同じであり、 $R^2$  がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(532)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (514) の定義に同じであり、 $R^2$  が基  $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$  ( $m$ 、 $u$ 、 $A$ 、 $R^6$  及び  $R^7$  は前記一般式 (1) における定義に同じ。) である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体またはその塩

(533)  $G$  が基  $-C(R^2)(R^3)-X-$  を示し、 $X$  が単結合を示し、 $R^3$  が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$  が前記一般式 (1) における定義に同じであり、 $R^2$  が基  $-NR^4R^5$  ( $R^4$  及び  $R^5$  は前記一般式 (1) における定義に同じ。) を示し、 $R$  がピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジン基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジカルボニル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(534)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  が水素原子である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(535)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  が水酸基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(536)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(537)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(538)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(539)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルカノイル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(540)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  と  $R^3$  が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0080】(541)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  と  $R^3$  が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(542)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$  及び  $R$  は前記 (533) の定義

に同じであり、 $R^2$  と  $R^3$  が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(543)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  と  $R^3$  が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(544)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$  及び  $R$  は前記 (533) の定義に同じであり、 $R^2$  と  $R^3$  が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(545)  $G$  が基  $-C(R^2)(R^3)-X-$  を示し、 $X$  が単結合を示し、 $R^3$  が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$  が前記一般式 (1) における定義に同じであり、 $R^2$  が基  $-NR^4R^5$  ( $R^4$  及び  $R^5$  は前記一般式 (1) における定義に同じ。) を示し、 $R$  が前記【化5】で示される基 ( $R^6$  及び  $p$  は前記一般式 (1) における定義に同じ。 $R^6$  は水素原子を示す。) である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(546)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (545) の定義に同じであり、 $R^2$  が水素原子である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(547)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (545) の定義に同じであり、 $R^2$  が水酸基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(548)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (545) の定義に同じであり、 $R^2$  がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(549)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (545) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(550)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (545) の定義に同じであり、 $R^2$  が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0081】(551)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (545) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルカノイル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(552)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$  及び  $R$  は前記 (545) の定義に同じであり、 $R^2$  と  $R^3$  が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0082】(553)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$  及び  $R$  は前記 (545) の定義に同じであり、 $R^2$  と  $R^3$  が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式 (1) で表わさ



れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(554) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(545)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(555) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(545)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(556) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(545)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(557) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが単結合を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-N $R^4$ R $R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(558) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(559) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(560) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0083】(561) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(562) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(563) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(564) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(565) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(557)の定義

に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(566) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(567) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(568) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(569) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが単結合を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-N $R^4$ R $R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(570) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0084】(571) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(572) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(573) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(574) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(575) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(576) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(577) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(578) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(579) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(580) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0085】(581) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが単結合を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>は低級ニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(582) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(583) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(584) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(585) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(586) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(587) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(588) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(589) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(590) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0086】(591) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(592) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(593) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが単結合を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(594) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(595) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(596) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(597) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(598) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(599) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の

定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(600) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0087】(601) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(602) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(603) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(604) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(605) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが単結合を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-N $R^4R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記〔化5〕で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(606) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(607) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(608) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(609) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(610) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環

誘導体又はその塩。

【0088】(611) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(612) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(613) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(614) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(615) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(616) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(617) Gが基-C( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが単結合を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^2$ が基-N $R^4R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが9-オキシフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(618) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(617)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(619) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(617)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(620) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(617)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0089】(621) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(617)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(622) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(617)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環

誘導体又はその塩

(623) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(617)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(624) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(617)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(625) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(617)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(626) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(617)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(627) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(617)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(628) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(617)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(629) Gが基-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが単結合を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R<sup>9</sup>は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(630) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0090】(631) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(632) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(633) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(634) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(635) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(636) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(637) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(638) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(639) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(640) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0091】(641) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(642) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(643) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(644) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(645) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(646) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(629)の

定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(647)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(629)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)— $m$ —A—(CO)— $u$ — $NR^6R^7$  ( $m$ 、 $u$ 、 $A$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(648)  $G$ が基—C( $R^2$ )( $R^3$ )— $X$ —を示し、 $X$ が単結合を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基— $NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R$ がキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(649)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(650)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0092】(651)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(652)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(653)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(654)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(655)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ 一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(656)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ 一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(657)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ がと $R^3$ 一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)

で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(658)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ 一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(659)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ 一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(660)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0093】(661)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(662)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(663)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(664)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(665)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(666)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(648)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)— $m$ —A—(CO)— $u$ — $NR^6R^7$  ( $m$ 、 $u$ 、 $A$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(667)  $G$ が基( $R^2$ )( $R^3$ )— $X$ —を示し、 $X$ が単結合を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基— $NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R$ がアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(668)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(667)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(669)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(667)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩  
(670) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0094】(671) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(672) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(673) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(674) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(675) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(676) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(677) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(678) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(679) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(680) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0095】(681) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(682) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(683) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(684) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(685) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(667)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)—m—A—(CO)—u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(686) Gが基(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xが単結合を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(687) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(686)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(688) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(686)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(689) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(686)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(690) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(686)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0096】(691) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(686)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(692) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(686)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(693) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(686)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(694) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(695) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(696) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(697) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(698) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(699) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(700) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0097】(701) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(702) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(703) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(704) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)—m—A—(CO)—u— $NR^6R^7$  (m、u、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(705) Gが基( $R^2$ )( $R^3$ )—X—を示し、Xが単結合を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同

じであり、 $R^2$ が基— $NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(706) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(707) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(708) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(709) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(710) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0098】(711) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(712) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(713) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(714) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(715) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(716) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(717) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記

一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(718) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(705)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(719) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(705)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(720) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(705)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0099】(721) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(705)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(722) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(705)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(723) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(705)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(724) Gが基(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xが単結合を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(725) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(726) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(727) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(728) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(729) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基

を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(730) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0100】(731) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(732) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(733) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(734) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(735) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(736) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(737) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(738) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(739) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(740) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0101】(741) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(724)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされ



ベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(754) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(545)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(755) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(545)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(756) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(545)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(757) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(557)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(758) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(557)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(759) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(557)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(760) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(557)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0103】(761) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(557)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(762) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(557)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(763) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(557)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(764) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(765) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導

(766) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(768) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表されるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(770) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(569)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

(772) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(774) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(776) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(581)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(778) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(780) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

(782) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表されるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(784) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(593)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)

の塩  
(786) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(605)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導

体又はその塩  
(787) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(605)の  
定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アル  
キル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテ

ロ環誘導体又はその塩  
(788) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(605)の  
定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置  
換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされる

ペンゾヘテロ環誘導体又はその塩  
(789) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(605)の  
定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基  
置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わさ



で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(812) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(813) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(814) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(815) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(816) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(817) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(818) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(819) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(820) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0109】(821) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(822) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(823) Gが基( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが基=CH-を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-N $R^4$ R $R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記

【化5】で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は低級アルキル基を示す。)

である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(824) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(825) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(826) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(827) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(828) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(829) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(830) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0110】(831) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(832) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(833) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(834) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(835) Gが基( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが基=CH-を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義

に同じであり、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R$ が前記〔化5〕で示される基 ( $R^9$ 及び $p$ は前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(836)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(837)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(838)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(839)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(840)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0111】(841)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(842)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(843)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(844)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(845)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(846)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(835)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(847)  $G$ が基 ( $R^2$ ) ( $R^3$ )  $-X-$ を示し、 $X$ が基

$=CH-$ を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R$ が前記〔化5〕で示される基 ( $R^9$ 及び $p$ は前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(848)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(849)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(850)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0112】(851)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(852)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(853)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(854)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(855)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(856)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(857)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(858)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(847)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わさ

れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(859) Gが基(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(860) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0113】(861) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(862) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(863) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(864) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(865) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(866) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(867) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(868) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(869) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(870) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0114】(871) Gが基(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(872) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(873) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(874) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(875) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(876) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(877) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(878) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(879) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(880) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0115】(881) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低

級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(882) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(871)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(883) Gが基( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが基=CH-を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^2$ が基-N $R^4$ R $R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが9-オキソフルオレンニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(884) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(885) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(886) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(887) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(888) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(889) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(890) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0116】(891) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(892) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(893) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ

カルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(894) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(895) Gが基( $R^2$ )( $R^3$ )-X-を示し、Xが基=CH-を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-N $R^4$ R $R^5$ ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 $R^8$ は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(896) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(897) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(898) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(899) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(900) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0117】(901) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(902) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(903) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(904) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で

表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(905) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(906) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(907) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(908) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(909) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(910) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0118】(911) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(912) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(913) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(914) Gが基( $R^2$ )( $R^3$ )—X—を示し、Xが基=CH—を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(915) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩  
(916) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の

定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(917) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(918) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(919) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(920) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0119】(921) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(922) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(923) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(924) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(925) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(926) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(927) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(928) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテ



ロ環誘導体又はその塩

(929) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(914)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(930) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(914)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0120】(931) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(914)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(932) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(914)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(933) Gが基(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(934) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(935) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(936) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(937) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(938) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(939) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(940) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0121】(941) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(942) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(943) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(944) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(945) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(946) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(947) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(948) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(949) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(950) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0122】(951) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(933)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(952) Gが基(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級ア

ルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R$ がチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(953)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(954)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(955)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(956)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(957)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(958)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(959)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(960)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0123】(961)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(962)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(963)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(964)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(965)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(966)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(967)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(968)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(969)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(970)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(952)の定義に同じであり、 $R^2$ が基 $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$  ( $m$ 、 $u$ 、 $A$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0124】(971)  $G$ が基 $(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 $X$ が基 $=CH-$ を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基 $-NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R$ がチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(972)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(971)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(973)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(971)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(974)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(971)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(975)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R$ は前記(971)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされる

ベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(976) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(977) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(978) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(979) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(980) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0125】(981) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(982) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(983) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(984) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(985) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(986) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(987) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わさ

れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(988) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(989) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(971)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(990) Gが基(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0126】(991) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(990)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(992) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(990)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(993) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(990)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(994) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(990)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(995) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(990)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(996) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(990)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(997) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(990)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(998) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(990)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(999) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(990)の定義

に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1000) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0127】(1001) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1002) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1003) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1004) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1005) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1006) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1007) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1008) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)—m—A—(CO)—u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1009) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1010) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0128】(1011) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前

記(799)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1012) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1013) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1014) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1015) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)—m—A—(CO)—u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1016) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1017) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1018) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1019) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1020) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0129】(1021) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1022) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)—m—A—(CO)—u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1023) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(823)



置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1048) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1049) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1050) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(859)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0132】(1051) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1052) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1053) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1054) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1055) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1056) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1057) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(871)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1058) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(883)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1059) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(883)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基

である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1060) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(883)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0133】(1061) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(883)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1062) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(883)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1063) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(883)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1064) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(883)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1065) Gが基—Y—C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—を示し、Yが基—NR<sup>4</sup>—(R<sup>4</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rがピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1066) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1067) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1068) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1069) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1070) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(106

5) の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0134】(1071) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1072) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1073) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1074) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1075) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1076) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1077) Gが基-Y-C( $R^2$ )( $R^3$ )-を示し、Yが基-NR<sup>A</sup>-( $R^A$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。 $R^8$ は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1078) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1079) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1080) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0135】(1081) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1082) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1083) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1084) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1085) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1086) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1087) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1088) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1089) Gが基-Y-C( $R^2$ )( $R^3$ )-を示し、Yが基-NR<sup>A</sup>-( $R^A$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基( $R^9$ 及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。 $R^8$ は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1090) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1089)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0136】(1091) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1089)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基であ

る前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1092) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1093) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1094) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1095) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1096) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1097) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1098) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1099) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1100) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0137】(1101) Gが基-Y-C(R<sup>2</sup>)

(R<sup>3</sup>)-を示し、Yが基-NR<sup>A</sup>- (R<sup>A</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R<sup>9</sup>は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1102) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1103) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1104) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1105) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1106) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1107) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1108) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1109) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1110) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0138】(1111) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1112) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1113) Gが基-Y-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-を示し、Yが基-NR<sup>A</sup>- (R<sup>A</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が



水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基（R<sup>9</sup>及びpは前記一般式

（1）における定義に同じ。R<sup>8</sup>はニトロ基を示す。）である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1114）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1115）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1116）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1117）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1118）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1119）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1120）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0139】（1121）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1122）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1123）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1124）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1125）Gが基-Y-C（R<sup>2</sup>）（R<sup>3</sup>）-を示し、Yが基-NR<sup>4</sup>-（R<sup>4</sup>は前記一般式（1）における定義に同じ。）を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式（1）における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>（R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式（1）における定義に同じ。）を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基（R<sup>9</sup>及びpは前記一般式

（1）における定義に同じ。R<sup>8</sup>はハロゲン原子を示す。）である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1126）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1127）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1128）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1129）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1130）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0140】（1131）G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1132）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1133）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1134）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1135）G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

の塩

(1136) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1125)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1137) Gが基-Y-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-を示し、Yが基-NR<sup>A</sup>- (R<sup>A</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R<sup>8</sup>は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1138) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1139) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1140) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0141】(1141) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1142) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1143) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1144) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1145) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1146) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1147) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1148) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1149) Gが基-Y-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-を示し、Yが基-NR<sup>A</sup>- (R<sup>A</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが9-オキシフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1150) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0142】(1151) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1152) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1153) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1154) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1155) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1156) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1157) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベン

ゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1158) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1159) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1160) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0143】(1161) Gが基-Y-C (R<sup>2</sup>)

(R<sup>3</sup>) -を示し、Yが基-NR<sup>A</sup>- (R<sup>A</sup>は前記一般式

(1) における定義に同じ。)を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1) における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1) における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R<sup>9</sup>及びpは前記一般式(1) における定義に同じ。R<sup>8</sup>は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1162) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1163) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1164) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1165) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1166) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1167) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1168) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1161)の

定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1169) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1170) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0144】(1171) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記

(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1172) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1173) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1174) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1175) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1176) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1177) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1178) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1179) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-(O) m-A-(CO) u-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1) における定義に同じ。)である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1180) Gが基-Y-C (R<sup>2</sup>) (R<sup>3</sup>) -を示し、

Yが基-NR<sup>A</sup>- (R<sup>A</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0145】(1181) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1182) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1183) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1184) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1185) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1186) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1187) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキソ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1188) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1189) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1190) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0146】(1191) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記

(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1192) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1193) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1194) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1195) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1196) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1197) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1198) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-(O)m-A-

(CO)u-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1199) Gが基-Y-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-を示し、Yが基-NR<sup>A</sup>- (R<sup>A</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1200) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0147】(1201) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1202) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(119

9) の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1203) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1204) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1205) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1206) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1207) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1208) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1209) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1210) G、X、 $R^1$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ と $R^3$ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0148】(1211) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1212) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1213) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1214) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199

9) の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1215) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1216) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1217) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1199)の定義に同じであり、 $R^2$ が基—(O)— $m$ —A—(CO)— $u$ — $NR^6R^7$  ( $m$ 、 $u$ 、A、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1218) Gが基—Y—C( $R^2$ )( $R^3$ )—を示し、Yが基— $NR^4$ —( $R^4$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 $R^3$ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 $R^1$ が前記一般式(1)における定義に同じであり、 $R^2$ が基— $NR^4R^5$  ( $R^4$ 及び $R^5$ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1219) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 $R^2$ が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1220) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 $R^2$ が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0149】(1221) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 $R^2$ がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1222) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1223) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 $R^2$ が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1224) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$ 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 $R^2$ が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1225) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1226) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1227) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1228) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1229) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1230) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0150】(1231) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1232) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1233) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1234) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1235) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1236) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1218)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-(O)m-A-(CO)u-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1237) Gが基-Y-C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)-を示し、Yが基-NR<sup>4</sup>-(R<sup>4</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1238) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1239) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1240) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0151】(1241) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1242) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1243) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1244) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1245) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1246) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1247) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1248) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1249) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1250) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0152】(1251) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1252) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1253) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1254) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1255) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1256) Gが基—Y—C(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)—を示し、Yが基—NR<sup>4</sup>—(R<sup>4</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R<sup>3</sup>が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R<sup>1</sup>が前記一般式(1)における定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1257) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1258) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1259) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ置換低級ア

ルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1260) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0153】(1261) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1262) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1263) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1264) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1265) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1266) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1267) G、X、R<sup>1</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1268) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1269) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1270) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0154】(1271) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカ

ノイロキシ基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1272) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1273) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1274) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1275) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1276) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1277) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1278) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1279) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1280) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。 【0155】(1281) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が基—(O)m—A—(CO)u—NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(m、u、A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1282) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(1077)の定義に同じであり、R<sup>2</sup>が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (1283) G、X、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びRは前記(107

7) の定義に同じであり、 $R^2$  がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1284)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1077) の定義に同じであり、 $R^2$  がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1285)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1077) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1286)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1077) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1287)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1077) の定義に同じであり、 $R^2$  がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1288)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1077) の定義に同じであり、 $R^2$  が基  $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$  ( $m$ 、 $u$ 、 $A$ 、 $R^6$  及び  $R^7$  は前記一般式 (1) における定義に同じ。) である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1289)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1089) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1290)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1089) の定義に同じであり、 $R^2$  がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0156】 (1291)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1089) の定義に同じであり、 $R^2$  がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1292)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1089) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1293)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1089) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1294)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1089) の定義に同じであり、 $R^2$  がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1295)  $G$ 、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R$  は前記 (1089) の定義に同じであり、 $R^2$  が基  $-(O)m-A-$





7) の定義に同じであり、 $R^2$  がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1320) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1137) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0160】(1321) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1137) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1322) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1137) の定義に同じであり、 $R^2$  がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1323) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1137) の定義に同じであり、 $R^2$  が基 - (O) m - A - (CO) u - NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、 $R^6$  及び  $R^7$  は前記一般式 (1) における定義に同じ。) である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1324) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1149) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1325) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1149) の定義に同じであり、 $R^2$  がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1326) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1149) の定義に同じであり、 $R^2$  がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1327) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1149) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0161】(1328) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1149) の定義に同じであり、 $R^2$  が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1329) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1149) の定義に同じであり、 $R^2$  がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1330) G、X、 $R^1$ 、 $R^3$  及び R は前記 (1149) の定義に同じであり、 $R^2$  が基 - (O) m - A - (CO) u - NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (m、u、A、 $R^6$  及び  $R^7$  は前記一般式 (1) における定義に同じ。) である前記一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0162】(1331) G が基 - C ( $R^2$ ) ( $R^3$ ) -

X- を示し、X がメチレン基である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0163】(1332) G が基 - C ( $R^2$ ) ( $R^3$ ) - X- を示し、X が単結合である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1333) G が基 - C ( $R^2$ ) ( $R^3$ ) - X- を示し、X が基 = CH- である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1334) G が基 - C ( $R^2$ ) ( $R^3$ ) - X- を示し、X が基 - NR<sup>14</sup>- である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1335) G が基 - Y - C ( $R^2$ ) ( $R^3$ ) - である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1336) R が、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記 (1331) に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1337) R が前記〔化5〕で示される基である前記 (1331) に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1338) R が、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記 (1332) に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1339) R が前記〔化5〕で示される基である前記 (1332) に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1340) R が、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチ

アゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1333)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1341) Rが前記【化5】で示される基である前記(1333)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0164】(1342) Rが、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフエン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1334)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1343) Rが前記【化5】で示される基である前記(1334)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩  
(1344) Rが、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフエン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1335)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1345) Rが前記【化5】で示される基である前記(1335)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩  
(1346) R<sup>9</sup>が基-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1347) R<sup>9</sup>がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1348) R<sup>9</sup>が窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として

低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい）である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1349) R<sup>9</sup>が水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基-(A)m-CH<sub>2</sub>R<sup>12</sup>R<sup>13</sup>（Aは前記に同じ。R<sup>12</sup>は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R<sup>13</sup>はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。）である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1350) R<sup>9</sup>が基-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>である前記(1343)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1351) R<sup>9</sup>がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記(1343)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0165】(1352) R<sup>9</sup>が窒素原子、酸素原子又

は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい）である前記（1343）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1353） $R^9$ が水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基—(A)— $m$ —CH $R^{12}$ R $^{13}$ （Aは前記に同じ。 $R^{12}$ は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。 $R^{13}$ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。 $m$ は0又は1を示す。）である前記（1343）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1354） $R^9$ が基—NR $^{10}$ R $^{11}$ である前記（1345）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1355） $R^9$ がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記（1345）

に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1356） $R^9$ が窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい）である前記（1345）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1357） $R^9$ が水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基—(A)— $m$ —CH $R^{12}$ R $^{13}$ （Aは前記に同じ。 $R^{12}$ は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。 $R^{13}$ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。 $m$ は0又は1を示す。）である前記（1345）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1358） $R^2$ が基—NR $^4$ R $^5$ であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1359） $R^2$ が基—(O)— $m$ —A—(CO)—uNR $^6$ R $^7$ であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1360） $R^2$ が水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキ

シカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1361） $R^3$ が水酸基置換低級アルキル基である前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0166】（1362） $R^2$ と $R^3$ とが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1363） $R^2$ が基- $NR^4R^5$ であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1364） $R^2$ が基-（O） $m$ -A-（CO） $uNR^6R^7$ であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1365） $R^2$ が水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1366） $R^3$ が水酸基置換低級アルキル基である前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1367） $R^2$ と $R^3$ とが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1368） $R^2$ が基- $NR^4R^5$ であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1369） $R^2$ が基-（O） $m$ -A-（CO） $uNR^6R^7$ であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1370） $R^2$ が水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキ

シカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 $R^3$ が水素原子である前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1371） $R^3$ が水酸基置換低級アルキル基である前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0167】（1372） $R^2$ と $R^3$ とが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1373） $m$ が0、 $n$ が1、 $R^6$ 及び $R^7$ が同一又は異なっており、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記（1359）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1374） $m$ が0、 $n$ が1、 $R^6$ 及び $R^7$ が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する5～7員環の飽和複素環基（該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。）である前記（1359）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1375） $m$ 及び $n$ が共に1である前記（1359）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1376） $m$ が0、 $n$ が1、 $R^6$ 及び $R^7$ が同一又は異なっており、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記（1364）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1377） $m$ が0、 $n$ が1、 $R^6$ 及び $R^7$ が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する5～7員環の飽和複素環基（該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。）である前記（1364）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1378） $m$ 及び $n$ が共に1である前記（1364）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1379） $m$ が0、 $n$ が1、 $R^6$ 及び $R^7$ が同一又は異

なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1380) mが0、nが1、 $R^6$ 及び $R^7$ が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する5～7員環の飽和複素環基(該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1381) m及びnが共に1である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0168】(1382)  $R^1$ が水素原子又はハロゲン原子である前記(1336)～(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1383)  $R^1$ が低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基である前記(1336)～(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1384)  $R^2$ が基-(O)-m-A-(CO)-uNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>であり、 $R^3$ が水素原子である前記(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1385) 5-[ (4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[4-(4-メトキシフェニル)-2-メチルベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン

(1386) 5-[ (4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-シクロヘキシル-2-メチルベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン

(1387) 5-イソプロピルアミノカルボニルメチル-1-(2-クロロ-4-ジメチルアミノベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン。

【0169】上記一般式(1)に示される各基はより具体的にはそれぞれ次の通りである。

【0170】低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、tert-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ

基を例示できる。

【0171】低級アルキル基としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

【0172】ハロゲン原子としては、例えば弗素原子、塩素原子、臭素原子及び砒素原子が挙げられる。

【0173】低級アルカノイルオキシ基としては、例えばホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、ペンタノイルオキシ、tert-ブチルカルボニルオキシ、ヘキサノイルオキシ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイルオキシ基を挙げることができる。

【0174】置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基としては、例えば2, 2, 2-トリフルオロアセチル、2, 2, 2-トリクロロアセチル、2-クロロアセチル、2-ブロモアセチル、2-フルオロアセチル、2-ヨードアセチル、2, 2-ジフルオロアセチル、2, 2-ジブロモアセチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピオニル、3, 3, 3-トリクロロプロピオニル、3-クロロプロピオニル、2, 3-ジクロロプロピオニル、4, 4, 4-トリクロロブチリル、4-フルオロブチリル、5-クロロペンタノイル、3-クロロ-2-メチルプロピオニル、6-ブロモヘキサノイル、5, 6-ジブロモヘキサノイル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有していてもよい炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイル基を挙げることができる。

【0175】置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基としては、例えばアミノメトキシ、2-アミノエトキシ、1-アミノエトキシ、3-アミノプロポキシ、4-アミノブトキシ、5-アミノペンチルオキシ、6-アミノヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-アミノエトキシ、2-メチル-3-アミノプロポキシ、アセチルアミノメトキシ、1-アセチルアミノエトキシ、2-プロピオニルアミノエトキシ、3-イソプロピオニルアミノプロポキシ、4-ブチルアミノブトキシ、5-ペンタノイルアミノペンチルオキシ、6-ヘキサノイルアミノヘキシルオキシ、ホルミルアミノメトキシ、メチルアミノメトキシ、1-エチルアミノエトキシ、2-プロピルアミノエトキシ、3-イソプロピルアミノプロポキシ、4-ブチルアミノブトキシ、5-ペンチルアミノペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ、ジメチルアミノメトキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メトキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エトキシ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群より選ばれ

た基を1～2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0176】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0177】低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基としては、例えばメトキシカルボニルメトキシ、3-メトキシカルボニルプロポキシ、エトキシカルボニルメトキシ、3-エトキシカルボニルプロポキシ、4-エトキシカルボニルブトキシ、5-イソプロポキシカルボニルペンチルオキシ、6-プロポキシカルボニルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-ブトキシカルボニルエトキシ、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロポキシ、2-ペンチルオキシカルボニルエトキシ、ヘキシルオキシカルボニルメトキシ基等のアルコキシカルボニル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基である炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルアルコキシ基を挙げることができる。

【0178】カルボキシ基置換低級アルコキシ基としては、例えば、カルボキシメトキシ、2-カルボキシエトキシ、1-カルボキシエトキシ、3-カルボキシプロポキシ、4-カルボキシブトキシ、5-カルボキシペンチルオキシ、6-カルボキシヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-カルボキシエトキシ、2-メチル-3-カルボキシプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるカルボキシアルコキシ基を挙げることができる。

【0179】置換基として低級アルキル基を有するアミノカルボニル低級アルコキシ基としては、メチルアミノカルボニルメトキシ、1-エチルアミノカルボニルエトキシ、2-プロピルアミノカルボニルエトキシ、3-イソプロピルアミノカルボニルプロポキシ、4-ブチルアミノカルボニルブトキシ、5-ペンチルアミノカルボニルペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノカルボニルヘキシルオキシ、ジメチルアミノカルボニルメトキシ、3-ジエチルアミノカルボニルプロポキシ、ジエチルアミノカルボニルメトキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)カルボニルメトキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)カルボニルエトキシ基等の置換基として炭

素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有するアミノカルボニル基を有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0180】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-クロロベンゾイル、4-クロロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-フルオロベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、2-ブロモベンゾイル、3-ブロモベンゾイル、4-ブロモベンゾイル、2-ヨードベンゾイル、3-ヨードベンゾイル、4-ヨードベンゾイル、3, 4-ジクロロベンゾイル、2, 6-ジクロロベンゾイル、2, 3-ジクロロベンゾイル、2, 4-ジクロロベンゾイル、3, 4-ジフルオロベンゾイル、3, 5-ジブロモベンゾイル、3, 4, 5-トリクロロベンゾイル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0181】カルボキシ置換低級アルキル基としては、例えばカルボキシメチル、2-カルボキシエチル、1-カルボキシエチル、3-カルボキシプロピル、4-カルボキシブチル、5-カルボキシペンチル、6-カルボキシヘキシル、1, 1-ジメチル-2-カルボキシエチル、2-メチル-3-カルボキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルボキシアルキル基を挙げることができる。

【0182】低級アルコキシカルボニル基置換低級アルキル基としては、例えばメトキシカルボニルメチル、3-メトキシカルボニルプロピル、エトキシカルボニルメチル、3-エトキシカルボニルプロピル、4-エトキシカルボニルブチル、5-イソプロポキシカルボニルペンチル、6-プロポキシカルボニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-ブトキシカルボニルエチル、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロピル、2-ペンチルオキシカルボニルエチル、ヘキシルオキシカルボニルメチル基等のアルコキシカルボニル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基である炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルアルキル基を挙げることができる。

【0183】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基としては、例えば、2-アミノアセチルオキシ、3-アミノプロピオニルオキシ、2-アミノプロピオニルオキシ、4-アミノブチリルオキシ、2, 2-ジメチル-3-アミノプロピオニルオキシ、5-アミノペンタノイルオキシ、6-アミノヘキサノイルオキシ、2-メチル-3-アミノプロピオニルオキシ、2-メチルアミノアセチルオキシ、3-エチルアミノプロピオニルオキシ、2-プロピルアミノプロピオニルオキシ、4-イソプロピルアミノブチリルオキシ、4-ブチルアミノブチリルオキシ、4-tert-ブチルアミノブチリルオキシ、5-ペンチ

ルアミノペンタノイルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキサノイルオキシ、2-ジメチルアミノアセチルオキシ、3-ジエチルアミノプロピオニルオキシ、2-ジメチルアミノプロピオニルオキシ、2-(N-エチル-N-プロピルアミノ)アセチルオキシ、3-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)プロピオニルオキシ等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基を例示できる。

【0184】低級アルカノイル基としては、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、tert-ブチルカルボニル、ヘキサノイル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基が挙げられる。

【0185】低級アルキリデン基としては、例えば、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、ペンチリデン、ヘキシリデン基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

【0186】低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基としては、例えばエトキシカルボニルメチリデン、2-メトキシカルボニルエチリデン、3-イソプロポキシカルボニルプロピリデン、2-プロポキシカルボニルイソプロピリデン、4-ブトキシカルボニルブチリデン、5-ペンチルオキシカルボニルペンチリデン、6-ヘキシルオキシカルボニルヘキシリデン基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

【0187】低級アルコキシ置換低級アルキリデン基としては、例えば、メトキシメチリデン、2-エトキシエチリデン、3-プロポキシプロピリデン、2-イソプロポキシイソプロピリデン、4-ブトキシブチリデン、5-ペンチルオキシペンチリデン、6-ヘキシルオキシヘキシリデン基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

【0188】フェニル置換低級アルキリデン基としては、例えばフェニルメチリデン、2-フェニルエチリデン、3-フェニルプロピリデン、2-フェニルプロピリデン、4-フェニルブチリデン、5-フェニルペンチリデン、6-フェニルヘキシリデン基等のフェニル置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキリデン基を例示できる。

【0189】低級アルキレン基としては、例えばメチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等の炭素数1

~6の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を例示できる。

【0190】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基としては、例えば、アミノメチル、2-アミノエチル、1-アミノエチル、3-アミノプロピル、4-アミノブチル、5-アミノペンチル、6-アミノヘキシル、1,1-ジメチル-2-アミノエチル、2-メチル-3-アミノプロピル、メチルアミノメチル、1-エチルアミノエチル、2-プロピルアミノエチル、3-イソプロピルアミノプロピル、4-ブチルアミノブチル、5-ペンチルアミノペンチル、6-ヘキシルアミノヘキシル、ジメチルアミノメチル、2-ジエチルアミノエチル、2-ジメチルアミノエチル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0191】R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>又はR<sup>B</sup>及びR<sup>C</sup>が結合する窒素原子と共に、窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する5~7員環の飽和複素環基としては、例えばピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、ホモピペラジニル基等を例示できる。

【0192】低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換した上記複素環基としては、例えば、4-メチルピペラジニル、3,4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、3,4,5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-エチルホモピペラジニル、4-メチルホモピペラジニル、4-ヘキシルピペラジニル、4-ジフェニルメチルピペラジニル、4-ベンジルピペラジニル、3-メチル-4-ベンジルピペラジニル、3-(2-フェニルエチル)ピロリジニル、2-(1-フェニルエチル)ピロリジニル、4-(3-フェニルプロピル)ピペリジニル、3-(4-フェニルブチル)モルホリノ、3-(5-フェニルペンチル)ピペリジニル、4-(6-フェニルヘキシル)ピペラジニル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、フェニル基を1~2個有するアルキル基なる群から選ばれた基が1~3個置換した上記複素環基を例示できる。

【0193】低級アルキル基が置換した上記複素環基としては、例えば、4-メチルピペラジニル、3,4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、3,4,5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-メチルホモピペラジニル、4-ヘキシルピペラジニル基等の炭素数1~6



の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基が1～3個置換した上記複素環基を例示できる。

【0194】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-プロピルフェニル、4-ブチルフェニル、2-ペンチルフェニル、3-ヘキシルフェニル、3, 4-ジメチルフェニル、3, 4, 5-トリメチルフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0195】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-プロポキシフェニル、4-ブトキシフェニル、2-ペンチルオキシフェニル、3-ヘキシルオキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジエトキシフェニル、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0196】ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基としては、例えば、ピリジルカルボニル、2-フェニルピリジルカルボニル、3-フェニルピリジルカルボニル、4-フェニルピリジルカルボニル、2-(2-メチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-エチルフェニル)ピリジルカルボニル、4-(3-プロピルフェニル)ピリジルカルボニル、2-(4-ブチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-ペンチルフェニル)ピリジルカルボニル、4-(3-ヘキシルフェニル)ピリジルカルボニル、2-(3, 4-ジメチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-ピリジル)ピリジルカルボニル、2-(3-ピリジル)ピリジルカルボニル、4-(4-ピリジル)ピリジルカルボニル基等のピリジン環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基を例示できる。

【0197】フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-

フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、2-クロロベンジル、2-(3-クロロフェニル)エチル、2-フルオロベンジル、1-(4-クロロフェニル)エチル、3-(2-フルオロフェニル)プロピル、4-(3-フルオロフェニル)ブチル、5-(4-フルオロフェニル)ペンチル、1, 1-ジメチル-2-(2-プロモフェニル)エチル、6-(3-プロモフェニル)ヘキシル、4-プロモベンジル、2-(2-ヨードフェニル)エチル、1-(3-ヨードフェニル)エチル、3-(4-ヨードフェニル)プロピル、3, 4-ジクロロベンジル、3, 5-ジクロロベンジル、2, 6-ジクロロベンジル、2, 3-ジクロロベンジル、2, 4-ジクロロベンジル、3, 4-ジフルオロベンジル、3, 5-ジプロモベンジル、3, 4, 5-トリクロロベンジル、3, 5-ジクロロ-4-ヒドロキシベンジル、3, 5-ジメチル-4-ヒドロキシベンジル、2-メトキシ-3-クロロベンジル、2-メチルベンジル、2-(2-メチルフェニル)エチル、1-(3-メチルフェニル)エチル、3-(4-メチルフェニル)プロピル、4-(2-エチルフェニル)ブチル、5-(3-プロピルフェニル)ペンチル、6-(4-ブチルフェニル)ヘキシル、2-(2-ペンチルフェニル)エチル、1-(3-ヘキシルフェニル)エチル、3-(3, 4-ジメチルフェニル)プロピル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)エチル、(2-メチル-6-クロロフェニル)メチル、3-フェニル-2-ヒドロキシプロピル、2-フェニル-2-ヒドロキシエチル、1-フェニル-1-ヒドロキシメチル、3-(4-メチルフェニル)-3-ヒドロキシプロピル、4-(3-クロロフェニル)-4-ヒドロキシブチル、5-(2-プロモフェニル)-5-ヒドロキシペンチル、6-(4-フルオロフェニル)-6-ヒドロキシヘキシル基等のアルキル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、該アルキル基部分に水酸基を有することのある、且つフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェニルアルキル基を例示できる。

【0198】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基としては、例えばフェノキシメチル、2-フェノキシエチル、1-フェノキシエチル、4-フェノキシブチル、5-フェノキシペンチル、6-フェノキシヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェノキシエチル、2-メチル-3-フェノキシプロピル、(2-メチルフェノキシ)メチル、2-(2-メチルフェノキシ)エチル、3-フェノキシプロピル、4-(3-メチルフェノキシ)ブチル、5-(2-エチルフェノキシ)ペンチル、6-(3-プロピ

ルフェノキシ) ヘキシル、(4-ブチルフェノキシ) メチル、2-(2-ペンチルフェノキシ) エチル、1-(3-ヘキシルフェノキシ) エチル、3-(3, 4-ジメチルフェノキシ) プロピル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) エチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのあるフェノキシ基置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0199】フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェノキシアセチル、2-フェノキシプロピオニル、3-フェノキシプロピオニル、2-フェノキシブチリル、4-フェノキシブチリル、2, 2-ジメチル-3-フェノキシプロピオニル、5-フェノキシペンタノイル、6-フェノキシヘキサノイル、2-(2-クロロフェノキシ) アセチル、2-(3-クロロフェノキシ) アセチル、2-(4-クロロフェノキシ) アセチル、2-(2-フルオロフェノキシ) アセチル、2-(3-フルオロフェノキシ) アセチル、3-(4-フルオロフェノキシ) プロピオニル、2-(2-ブロモフェノキシ) プロピオニル、4-(3-ブロモフェノキシ) ブチリル、5-(4-ブロモフェノキシ) ペンタノイル、6-(2-ヨードフェノキシ) ヘキサノイル、2-(3-ヨードフェノキシ) アセチル、3-(4-ヨードフェノキシ) プロピオニル、4-(3, 4-ジクロロフェノキシ) ブチリル、2-(3, 4-ジクロロフェノキシ) アセチル、2-(2, 6-ジクロロフェノキシ) アセチル、2-(2, 3-ジクロロフェノキシ) アセチル、2-(2, 4-ジクロロフェノキシ) アセチル、2-(3, 4-ジフルオロフェノキシ) アセチル、3-(3, 5-ジブロモフェノキシ) プロピオニル、2-(3, 4, 5-トリクロロフェノキシ) アセチル、2-(2-メチルフェノキシ) アセチル、2-(3-メチルフェノキシ) アセチル、2-(4-メチルフェノキシ) アセチル、3-(2-エチルフェノキシ) プロピオニル、2-(3-エチルフェノキシ) プロピオニル、4-(4-エチルフェノキシ) ブチリル、5-(4-イソプロピルフェノキシ) ペンタノイル、6-(3-ブチルフェノキシ) ヘキサノイル、3-(4-ペンチルフェノキシ) プロピオニル、2-(4-ヘキシルフェノキシ) アセチル、2-(3, 4-ジメチルフェノキシ) アセチル、2-(3, 4-ジエチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 4-ジメチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 5-ジメチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 6-ジメチルフェノキシ) アセチル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) アセチル、2-(3-クロロ-4-メチルフェノキシ) アセチル、2-(3-ジメチルアミノフェノキシ) アセチル、2-(3-ニトロフェノキシ) アセチル、2-(2-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(3-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(4-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(2-フェニルフェノキシ) アセチル、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) アセチル、3-(2-アミノフェノキシ) プロピオニル、4-(4-エチルアミノフェノキシ) ブチリル、5-(2, 3-ジメトキシフェノキシ) ペンタノイル、6-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) ヘキサノイル、3-(2-エトキシフェノキシ) プロピオニル、4-(3-プロボキシフェノキシ) プロピオニル、2-(4-ブトキシフェノキシ) アセチル、3-(4-ペンチルオキシフェノキシ) プロピオニル、4-(4-ヘキシルオキシフェノキシ) ブチリル、3-(2-ニトロフェノキシ) プロピオニル、4-(4-ニトロフェノキシ) ブチリル、3-(3-フェニルフェノキシ) プロピオニル、4-(4-フェニルフェノキシ) ブチリル、5-[3-(2, 2-トリクロロエチル) フェノキシ] ペンタノイル、6-[4-(5-プロモヘキシル) フェノキシ] ヘキサノイル、2-(4-フェニル-2-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(2-フェニル-4-メチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 4, 6-トリニトロフェノキシ) アセチル、2-(2, 4-ジニトロフェノキシ) アセチル、2-(3-フェニル-2-ジメチルアミノフェノキシ) アセチル、2-フェノキシ-2, 2-ジフルオロアセチル、3-(3-ジメチルアミノフェノキシ)-3-プロモプロピオニル、4-(3-ニトロフェノキシ)-3, 4, 4-トリクロロブチリル、5-(2-メトキシフェノキシ)-5-ヨードペンタノイル、2-(2, 6-ジクロロフェノキシ)-2-クロロアセチル、2-(4-メチルフェノキシ)-2, 2-ジフルオロアセチル、2-(2-フェニルフェノキシ)-2, 2-ジフルオロアセチル、6-(2-フェニルフェノキシ)-6-プロモヘキサノイル、2-(2-アセチルアミノフェノキシ) アセチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基、ニトロ基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を1~3個有することのあるアルカノイル部分の炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのあるフェノキシアルカノイル基を例示できる。

ル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) アセチル、2-(3-クロロ-4-メチルフェノキシ) アセチル、2-(3-ジメチルアミノフェノキシ) アセチル、2-(3-ニトロフェノキシ) アセチル、2-(2-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(3-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(4-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(2-フェニルフェノキシ) アセチル、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) アセチル、3-(2-アミノフェノキシ) プロピオニル、4-(4-エチルアミノフェノキシ) ブチリル、5-(2, 3-ジメトキシフェノキシ) ペンタノイル、6-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) ヘキサノイル、3-(2-エトキシフェノキシ) プロピオニル、4-(3-プロボキシフェノキシ) プロピオニル、2-(4-ブトキシフェノキシ) アセチル、3-(4-ペンチルオキシフェノキシ) プロピオニル、4-(4-ヘキシルオキシフェノキシ) ブチリル、3-(2-ニトロフェノキシ) プロピオニル、4-(4-ニトロフェノキシ) ブチリル、3-(3-フェニルフェノキシ) プロピオニル、4-(4-フェニルフェノキシ) ブチリル、5-[3-(2, 2-トリクロロエチル) フェノキシ] ペンタノイル、6-[4-(5-プロモヘキシル) フェノキシ] ヘキサノイル、2-(4-フェニル-2-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(2-フェニル-4-メチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 4, 6-トリニトロフェノキシ) アセチル、2-(2, 4-ジニトロフェノキシ) アセチル、2-(3-フェニル-2-ジメチルアミノフェノキシ) アセチル、2-フェノキシ-2, 2-ジフルオロアセチル、3-(3-ジメチルアミノフェノキシ)-3-プロモプロピオニル、4-(3-ニトロフェノキシ)-3, 4, 4-トリクロロブチリル、5-(2-メトキシフェノキシ)-5-ヨードペンタノイル、2-(2, 6-ジクロロフェノキシ)-2-クロロアセチル、2-(4-メチルフェノキシ)-2, 2-ジフルオロアセチル、2-(2-フェニルフェノキシ)-2, 2-ジフルオロアセチル、6-(2-フェニルフェノキシ)-6-プロモヘキサノイル、2-(2-アセチルアミノフェノキシ) アセチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基、ニトロ基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を1~3個有することのあるアルカノイル部分の炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのあるフェノキシアルカノイル基を例示できる。

【0200】置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基としては、例えば、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、tert-ブチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル、ヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル、ジペンチルアミノカルボニル、ジヘキシルアミノカルボニル、N-メチル-N-エチルアミノカルボニル、N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル、N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル、N-メチル-N-ヘキシルアミノカルボニル、N-エチル-N-（ピリジルメチル）アミノカルボニル、N-エチル-N-ベンジルアミノカルボニル、ベンジルアミノカルボニル、（2-フェニルエチル）アミノカルボニル、（1-フェニルエチル）アミノカルボニル、（3-フェニルプロピル）アミノカルボニル、（4-フェニルブチル）アミノカルボニル、（5-フェニルペンチル）アミノカルボニル、（6-フェニルヘキシル）アミノカルボニル、N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル、ピリジルメチルアミノカルボニル、（2-ピリジルエチル）アミノカルボニル、（3-ピリジルプロピル）アミノカルボニル、（4-ピリジルブチル）アミノカルボニル、（5-ピリジルペンチル）アミノカルボニル、（6-ピリジルヘキシル）アミノカルボニル、N-（ピリジルメチル）-N-ベンジルアミノカルボニル、N-メチル-N-（ピリジルメチル）アミノカルボニル基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基及びアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基なる群より選ばれた基を1～2個有することのあるアミノカルボニル基を例示できる。

【0201】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、2-メチルベンゾイル、3-メチルベンゾイル、4-メチルベンゾイル、2-エチルベンゾイル、3-プロピルベンゾイル、4-ブチルベンゾイル、2-ペンチルベンゾイル、3-ヘキシルベンゾイル、3, 4-ジメチルベンゾイル、3, 4, 5-トリメチルベンゾイル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0202】シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル基等の炭素数3～8のシクロアルキル基を例示できる。

【0203】低級アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基を例示できる。

【0204】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、4-フェニルブチリル、2, 2-ジメチル-3-フェニルプロピオニル、5-フェニルペンタノイル、6-フェニルヘキサノイル、2-（2-メチルフェニル）アセチル、2-（3-メチルフェニル）アセチル、2-（4-メチルフェニル）アセチル、3-（2-エチルフェニル）プロピオニル、2-（3-エチルフェニル）プロピオニル、4-（4-エチルフェニル）ブチリル、5-（4-イソプロピルフェニル）ペンタノイル、6-（3-ブチルフェニル）ヘキサノイル、3-（4-ペンチルフェニル）プロピオニル、2-（4-ヘキシルフェニル）アセチル、2-（3, 4-ジメチルフェニル）アセチル、2-（3, 4-ジエチルフェニル）アセチル、2-（2, 4-ジメチルフェニル）アセチル、2-（2, 5-ジメチルフェニル）アセチル、2-（2, 6-ジメチルフェニル）アセチル、2-（3, 4, 5-トリメチルフェニル）アセチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェニルアルカノイル基を例示できる。

【0205】ハロゲン原子置換低級アルコキシ基としては、例えば、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、フルオロメトキシ、ヨードメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジプロモメトキシ、2-クロロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、3-ブロモプロボキシ、3-クロロプロボキシ、2, 3-ジクロロプロボキシ、4, 4, 4-トリクロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロペンチルオキシ、3-クロロ-2-メチルプロボキシ、5-プロモヘキシルオキシ、5, 6-ジクロロヘキシルオキシ基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0206】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基としては、例えば、アミノメトキシ、2-アミノエトキシ、1-アミノエトキシ、3-アミノプロボキシ、4-アミノブトキシ、5-アミノペンチルオキシ、6-アミノヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-アミノエトキシ、2-メチル-3-アミノプロボキシ、メチルアミノメトキシ、1-エチルアミノエトキシ、2-プロピルアミノエトキシ、3-イソプロピルアミノプロボキシ、4-イソプロピルア

ミノプトキシ、4-ブチルアミノプトキシ、4-tert-ブチルアミノプトキシ、5-ペンチルアミノペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ、ジメチルアミノメトキシ、2-ジエチルアミノエトキシ、2-ジメチルアミノエトキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メトキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エトキシ等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0207】フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-プロピルフェニル、4-ブチルフェニル、2-ペンチルフェニル、3-ヘキシルフェニル、3,4-ジメチルフェニル、3,4,5-トリメチルフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、3-プロポキシフェニル、4-プロポキシフェニル、4-ブトキシフェニル、2-ペンチルオキシフェニル、3-ヘキシルオキシフェニル、2,4-ジメトキシフェニル、3,4-ジエトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、2,4-ジヒドロキシフェニル、3,4-ジヒドロキシフェニル、2,4,6-トリヒドロキシフェニル、2-アセチルオキシフェニル、3-プロピオニルオキシフェニル、2-ベンジルオキシフェニル、3-ベンジルオキシフェニル、4-ベンジルオキシフェニル、2-(2-フェニルエトキシ)フェニル、3-(3-フェニルプロポキシ)フェニル、4-(4-フェニルブトキシ)フェニル、3-(1-フェニルエトキシ)フェニル、2-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル、2,4-ジベンジルオキシフェニル、3,4-ジベンジルオキシフェニル、3,4,5-トリベンジルオキシフェニル、4-ブチルオキシフェニル、2-ペンタノイルオキシフェニル、4-ヘキサノイルオキシフェニル、2,4-ジアセチルオキシフェニル、2,6-ジアセチルオキシフェニル、3,4,5-トリアセチルオキシフェニル、2-トリフルオロメトキシフェニル、3-(2-クロロエトキシ)フェニル、2-(3-プロモプロポキシ)フェニル、4-ヨードメトキシフェニル、2-(2,3-ジクロロプロポキシ)フェニル、3-(4-

-フルオロプロポキシ)フェニル、4-(3-クロロ-2-メチルプロポキシ)フェニル、2-(5-プロモヘキシルオキシ)フェニル、3-(5,6-ジクロロヘキシルオキシ)フェニル、4-(2,2,2-トリクロロエトキシ)フェニル、2,4-ビストリフルオロメトキシフェニル、2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル、2-アミノメトキシフェニル、3-(1-アミノエトキシ)フェニル、4-(3-アミノプロポキシ)フェニル、2-(4-アミノプトキシ)フェニル、3-(5-アミノペンチルオキシ)フェニル、4-(6-アミノヘキシルオキシ)フェニル、2-メチルアミノメトキシフェニル、3-(2-プロピルアミノエトキシ)フェニル、2-(3-イソプロピルアミノプロポキシ)フェニル、4-(4-ブチルアミノプトキシ)フェニル、2-(5-ペンチルアミノペンチルオキシ)フェニル、3-(6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ)フェニル、4-ジメチルアミノメトキシフェニル、2-(N-エチル-N-プロピルアミノメトキシ)フェニル、2-メチル-4-メトキシフェニル、2-メチル-6-ヒドロキシフェニル、4-メチル-2-(3-プロモプロポキシ)フェニル、4-メトキシ-2-(3-イソプロピルアミノプロポキシ)フェニル、2-フェニルフェニル、3-フェニルフェニル、4-フェニルフェニル、2-ニトロフェニル、3-ニトロフェニル、4-ニトロフェニル、2,3-ジニトロフェニル、2,4,6-トリニトロフェニル、2-アミノエチル、3-アミノフェニル、4-アミノフェニル、2,4-ジアミノフェニル、3,4,5-トリアミノフェニル、4-アセチルアミノフェニル、2-プロピオニルアミノフェニル、3-ブチルアミノフェニル、4-ペンタノイルアミノフェニル、4-ヘキサノイルアミノフェニル、2,3-ジアセチルアミノフェニル、2,4,6-トリアセチルアミノフェニル等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、水酸基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基、置換基としてハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、ニトロ基、置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基、及び置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0208】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基としては、例えば、アニリノメチル、2-アニリノエチル、1-アニリノエチル、3-アニリノプロピル、4-アニリノブチル、1,1-ジメチル-2-アニリノエチル、5-アニリノペンチル、6-アニリノヘキシル、2-メチ-

ル-3-アニリノプロピル、(2-メチルアニリノ)メチル、2-(2-メチルアニリノ)エチル、1-(3-メチルアニリノ)エチル、3-(4-メチルアニリノ)プロピル、4-(2-エチルアニリノ)ブチル、5-(3-プロピルアニリノ)ペンチル、6-(4-ブチルアニリノ)ヘキシル、2-(2-ペンチルアニリノ)エチル、1-(3-ヘキシルアニリノ)エチル、3-(3,4-ジメチルアニリノ)プロピル、2-(3,4,5-トリメチルアニリノ)エチル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのあるアニリノアルキル基を例示できる。

【0209】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基としては、例えば、フェニルメトキシ、2-フェニルエトキシ、1-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-フェニルエトキシ、2-メチル-3-フェニルプロポキシ、(2-クロロフェニル)メトキシ、(2-ブromoフェニル)メトキシ、2-(4-フルオロフェニル)エトキシ、1-(4-ブromoフェニル)エトキシ、3-(3-ブromoフェニル)プロポキシ、4-(4-クロロフェニル)ブトキシ、5-(2-ヨードフェニル)ペンチルオキシ、6-(3-ヨードフェニル)ヘキシルオキシ、(2,6-ジクロロフェニル)メトキシ、

(2,3-ジクロロフェニル)メトキシ、(2,4-ジクロロフェニル)メトキシ、(3,4-ジフルオロフェニル)メトキシ、(3,4,5-トリクロロフェニル)メトキシ、(2-メトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(3-エトキシカルボニルフェニル)メトキシ、2-(4-イソプロポキシカルボニルフェニル)エトキシ、3-(2-ブトキシカルボニルフェニル)プロポキシ、4-(3-ペンチルオキシカルボニルフェニル)ブトキシ、5-(4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル)ペンチルオキシ、6-(2-メトキシカルボニルフェニル)ヘキシルオキシ、(2,4-ジメトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(2,4,6-トリエトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(2-カルバモイルフェニル)メトキシ、2-(3-メチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、1-(4-エチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、3-(2-イソプロピルアミノカルボニルフェニル)プロポキシ、4-(3-ブチルアミノカルボニルフェニル)ブトキシ、5-(4-ペンチルアミノカルボニルフェニル)ペンチルオキシ、6-

(2-ヘキシルアミノカルボニルフェニル)ヘキシルオキシ、(2-ジメチルアミノカルボニルフェニル)メトキシ、2-(3-ジブチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、1-(4-ジヘキシルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、3-[2-(N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル)フェニル]プロポキシ、(2-アミノメチルアミノカルボニルフェニル)メトキシ、2-[3-(2-アミノエチルアミノカルボニル)フェニル]エトキシ、3-[4-(3-アミノプロピルアミノカルボニル)フェニル]プロポキシ、4-[2-(4-アミノブチルアミノカルボニル)フェニル]ブトキシ、5-[3-(5-アミノペンチルアミノカルボニル)フェニル]ペンチルオキシ、6-[4-(6-アミノヘキシルアミノカルボニル)フェニル]ヘキシルオキシ、[2-(N-メチル-N-メチルアミノメチル)アミノカルボニルフェニル]メトキシ、2-[3-(3-イソプロピルアミノプロピルアミノカルボニル)フェニル]エトキシ、3-[4-[ (N-プロピル-N-(5-ペンチルアミノペンチル)アミノカルボニル)フェニル]プロポキシ、[2-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル]フェニル]メトキシ、[2-[N,N-ビス(ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル]フェニル]メトキシ、4-[3-(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチルアミノカルボニルフェニル]ブトキシ、5-[4-[N-(2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル)-N-エチルアミノカルボニル]フェニル]ペンチルオキシ、6-[4-クロロ-2-[N-ブチル-N-(6-ヘキシルアミノヘキシル)アミノカルボニル]フェニル]ヘキシルオキシ、[2-ブromo-4-(N-ヘキシル-N-ジメチルアミノメチル)アミノカルボニルフェニル]メトキシ、(2-メトキシカルボニル-3-クロロフェニル)メトキシ基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基並びに置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を1~3個有することがあり、且つアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基を例示できる。

【0210】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基としては、例えば、ベンゾイルメトキシ、2-ベンゾイルエトキシ、1-ベンゾイルエトキシ、3-ベンゾイルプロポキシ、4-ベンゾイルブトキシ、5-ベンゾイルヘキシルオキシ、6-ベンゾイルヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-ベンゾイルエトキシ、2-メチル-3-ベ

ンゾイルプロボキシ、2-（2-クロロベンゾイル）エトキシ、1-（3-クロロベンゾイル）エトキシ、（4-クロロベンゾイル）メトキシ、3-（2-フルオロベンゾイル）プロボキシ、4-（3-フルオロベンゾイル）ブトキシ、5-（4-フルオロベンゾイル）ベンチルオキシ、6-（2-プロモベンゾイル）ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-（3-プロモベンゾイル）エトキシ、2-メチル-3-（4-プロモベンゾイル）プロボキシ、（2-ヨードベンゾイル）メトキシ、2-（3-ヨードベンゾイル）エトキシ、3-（4-ヨードベンゾイル）プロボキシ、4-（3, 4-ジクロロベンゾイル）ブトキシ、5-（2, 6-ジクロロベンゾイル）ベンチルオキシ、6-（2, 3-ジクロロベンゾイル）ヘキシルオキシ、（2, 4-ジクロロベンゾイル）メトキシ、（3, 4-ジフルオロベンゾイル）メトキシ、（3, 5-ジプロモベンゾイル）メトキシ、（3, 4, 5-トリクロロベンゾイル）メトキシ基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することがあり、且つアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるベンゾイルアルコキシ基を例示できる。

【0211】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基としては、例えばスチリル、3-フェニル-2-プロペニル、3-フェニル-1-プロペニル、4-フェニル-3-ブテニル、4-フェニル-2-ブテニル、4-フェニル-1-ブテニル、5-フェニル-4-ペンテニル、5-フェニル-3-ペンテニル、5-フェニル-2-ペンテニル、5-フェニル-1-ペンテニル、1-メチル-3-フェニル-2-ブテニル、6-フェニル-5-ヘキセニル、1-メチルスチリル、2-, 3-もしくは4-クロロスチリル、3-（4-プロモフェニル）-2-プロペニル、3-（3-フルオロフェニル）-1-プロペニル、4-（4-ヨードフェニル）-3-ブテニル、5-（2-クロロフェニル）-4-ペンテニル、2-メチル-3-プロモスチリル、3, 4-ジクロロスチリル、3, 4, 5-トリクロロスチリル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのあるフェニル基を有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を例示できる。

【0212】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基としては、例えば、ベンゾイルメチル、2-ベンゾイルエチル、1-ベンゾイルエチル、3-ベンゾイルプロピル、4-ベンゾイルブチル、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル、5-ベンゾイルペンチル、6-ベンゾイルヘキシル、2-メチル-3-ベンゾイルプロピル、（2-メチルベンゾイル）メチル、2-（2-メチルベンゾイル）エチル、1-（3-メチルベンゾイル）エチル、3-（4-メチルベンゾイル）プロピル、4-（2-エ

チルベンゾイル）ブチル、5-（3-プロピルベンゾイル）ペンチル、6-（4-ブチルベンゾイル）ヘキシル、2-（2-ベンチルベンゾイル）エチル、1-（3-ヘキシルベンゾイル）エチル、3-（3, 4-ジメチルベンゾイル）プロピル、2-（3, 4, 5-トリメチルベンゾイル）エチル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるベンゾイルアルキル基を例示できる。

【0213】ピロリジニル置換低級アルコキシ基としては、例えば、（2-ピロリジニル）メトキシ、2-（2-ピロリジニル）エトキシ、1-（3-ピロリジニル）エトキシ、3-（2-ピロリジニル）プロボキシ、4-（3-ピロリジニル）ブトキシ、5-（2-ピロリジニル）ベンチルオキシ、6-（3-ピロリジニル）ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-（2-ピロリジニル）エトキシ、2-メチル-3-（3-ピロリジニル）プロボキシ、5-（1-ピロリジニル）ベンチルオキシ、2-（1-ピロリジニル）エトキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるピロリジニルアルコキシ基を例示できる。

【0214】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチルベンジル、2-（2-メチルフェニル）エチル、1-（3-メチルフェニル）エチル、3-（4-メチルフェニル）プロピル、4-（2-エチルフェニル）ブチル、5-（3-プロピルフェニル）ペンチル、6-（4-ブチルフェニル）ヘキシル、2-（2-ベンチルフェニル）エチル、1-（3-ヘキシルフェニル）エチル、3-（3, 4-ジメチルフェニル）プロピル、2-（3, 4, 5-トリメチルフェニル）エチル、（2-メチル-6-クロロフェニル）メチル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるフェニルアルキル基を例示できる。

【0215】低級アルコキシカルボニル基としては、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロボキシカルボニル、イソプロボキシカルボニル、ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、ベンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を例示できる。

【0216】置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級

アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基としては、例えば、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、tert-ブチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル、ヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル、ジペンチルアミノカルボニル、ジヘキシルアミノカルボニル、N-メチル-N-エチルアミノカルボニル、N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル、N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル、N-メチル-N-ヘキシルアミノカルボニル、アミノメチルアミノカルボニル、2-アミノエチルアミノカルボニル、1-アミノエチルアミノカルボニル、3-アミノプロピルアミノカルボニル、4-アミノブチルアミノカルボニル、5-アミノペンチルアミノカルボニル、6-アミノヘキシルアミノカルボニル、1, 1-ジメチル-2-アミノエチルアミノカルボニル、2-メチル-3-アミノプロピルアミノカルボニル、メチルアミノメチルアミノカルボニル、1-エチルアミノエチルアミノカルボニル、2-プロピルアミノエチルアミノカルボニル、3-イソプロピルアミノプロピルアミノカルボニル、4-ブチルアミノブチルアミノカルボニル、5-ペンチルアミノペンチルアミノカルボニル、6-ヘキシルアミノヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノメチルアミノカルボニル、2-ジエチルアミノエチルアミノカルボニル、2-ジメチルアミノエチルアミノカルボニル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチルアミノカルボニル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチルアミノカルボニル、N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル、N-エチル-N-(メチルアミノメチル)アミノカルボニル基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1～2個有することのあるアミノカルボニル基を例示できる。

【0217】置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基としては、例えば前記低級アルキル基に加えて、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2, 3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5, 5, 4-トリヒドロキシペンチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、1-ヒドロキシイソプロピル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基等の水酸基を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0218】カルバモイル基低級アルキル基としては、例えばカルバモイルメチル、2-カルバモイルエチル、1-カルバモイルエチル、3-カルバモイルプロピル、4-カルバモイルブチル、5-カルバモイルペンチル、6-カルバモイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエチル、2-メチル-3-カルバモイルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルバモイルアルキル基を例示できる。

【0219】アダマンチル基置換低級アルキル基としては、例えばアダマンチルメチル、2-アダマンチルエチル、1-アダマンチルエチル、3-アダマンチルプロピル、4-アダマンチルブチル、5-アダマンチルペンチル、6-アダマンチルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-アダマンチルエチル、2-メチル-3-アダマンチルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアダマンチルアルキル基を例示できる。

【0220】低級アルキルスルホニル基としては、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、tert-ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、ヘキシルスルホニル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を挙げることができる。

【0221】水酸基置換低級アルキル基としては、例えばヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2, 3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5, 5, 4-トリヒドロキシペンチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、1-ヒドロキシイソプロピル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基等の水酸基を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0222】フェニル低級アルキル基としては、例えばベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、2-メチル-3-フェニルプロピル、ジフェニルメチル、2, 2-ジフェニルエチル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、フェニル基を1～2個有するアルキル基を挙げることができる。

【0223】キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基としては、例えばキノリルカルボニル、2-フェニルキノリルカルボニル、3-フェニルキノリルカルボニル、4-フェニルキノリルカルボニル、5-フェニルキノリルカルボニル、6-フェニルキノリルカルボニル、7-フェニルキノリルカルボニル、8-フェニルキノリルカルボニル基等の

キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基を例示できる。

【0224】チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基としては、例えばチエニルカルボニル、2-フェニルチエニルカルボニル、3-フェニルチエニルカルボニル、4-フェニルチエニルカルボニル基等のチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基を例示できる。

【0225】チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基としては、例えばチアゾリルカルボニル、2-フェニルチアゾリルカルボニル、4-フェニルチアゾリルカルボニル、5-フェニルチアゾリルカルボニル基等のチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基を例示できる。

【0226】シクロアルキルカルボニル基としては、例えばシクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル基等の炭素数3～8のシクロアルキルカルボニル基を例示できる。

【0227】置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基としては、例えば前記置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基に加えて、2-ヒドロキシアセチル、3-ヒドロキシプロピオニル、2-ヒドロキシプロピオニル、4-ヒドロキシブチリル、5-ヒドロキシペンタノイル、6-ヒドロキシヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-ヒドロキシプロピオニル等の置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

【0228】ハロゲン原子置換低級アルキル基としては、例えばトリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジプロモメチル、2-クロロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、3-プロモプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、4, 4, 4-トリクロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2-メチルプロピル、5-プロモヘキシル、5, 6-ジクロロヘキシル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0229】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミ

ノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0230】置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基としては、例えば前記低級アルコキシカルボニル基に加えて、トリフルオロメトキシカルボニル、トリクロロメトキシカルボニル、クロロメトキシカルボニル、プロモメトキシカルボニル、フルオロメトキシカルボニル、ヨードメトキシカルボニル、ジフルオロメトキシカルボニル、ジプロモメトキシカルボニル、2-クロロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル、3-プロモプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2, 3-ジクロロプロポキシ、4, 4, 4-トリクロロプロポキシカルボニル、4-フルオロプロポキシカルボニル、5-クロロペンチルオキシカルボニル、3-クロロ-2-メチルプロポキシカルボニル、5-プロモヘキシルオキシカルボニル、5, 6-ジクロロヘキシルオキシカルボニル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有することもある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を例示できる。

【0231】低級アルコキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-メトキシアセチル、3-メトキシプロピオニル、2-エトキシアセチル、3-エトキシプロピオニル、4-エトキシブチリル、3-プロポキシプロピオニル、2-メトキシプロピオニル、6-プロポキシヘキサノイル、5-イソプロポキシペンタノイル、2, 2-ジメチル-3-ブトキシプロピオニル、2-メチル-3-tert-ブトキシプロピオニル、2-ペンチルオキシアセチル、2-ヘキシルオキシアセチル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基である炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシアルカノイル基を挙げることができる。

【0232】低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-アセチルオキシアセチル、3-アセチルオキシプロピオニル、2-プロピオニルオキシアセチル、3-プロピオニルオキシプロピオニル、4-プロピオニルオキシブチリル、3-ブチルオキシプロピオニル、2-アセチルオキシプロピオニル、6-プロピオニルオキシヘキサノイル、5-ブチルオキシペンタノイル、2, 2-ジメチル-3-ブチルオキシプロピオニル、2-ペンタノイルオキシアセチル、2-ヘキサノイルオキシアセチル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基である炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシア



ルカノイル基を挙げることができる。

【0233】キノリルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-キノリルオキシアセチル、3-キノリルオキシプロピオニル、2-キノリルオキシプロピオニル、4-キノリルオキシブチリル、2, 2-ジメチル-3-キノリルオキシプロピオニル、5-キノリルオキシペンタノイル、6-キノリルオキシヘキサノイル基等のアルカノイル基部分の炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるキノリルオキシアルカノイル基を例示できる。

【0234】フェニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えばベンジルオキシカルボニル、2-フェニルエトキシカルボニル、1-フェニルエトキシカルボニル、3-フェニルプロポキシカルボニル、4-フェニルブトキシカルボニル、5-フェニルペンチルオキシカルボニル、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェニルプロポキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフェニルアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0235】ベンゾイル低級アルキル基としては、例えばベンゾイルメチル、2-ベンゾイルエチル、1-ベンゾイルエチル、3-ベンゾイルプロピル、4-ベンゾイルブチル、5-ベンゾイルペンチル、6-ベンゾイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル、2-メチル-3-ベンゾイルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾイルアルキル基を挙げることができる。

【0236】キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-テトラヒドロキノリルオキシアセチル、3-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、2-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、4-テトラヒドロキノリルオキシブチリル、2, 2-ジメチル-3-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、5-テトラヒドロキノリルオキシペンタノイル、6-テトラヒドロキノリルオキシヘキサノイル、2- (1-メチルテトラヒドロキノリルオキシ) アセチル、2- (2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ) アセチル、3- (2-エチルテトラヒドロキノリルオキシ) プロピオニル、2- (3-プロピルテトラヒドロキノリルオキシ) プロピオニル、4- (4-ブチルテトラヒドロキノリルオキシ) ブチリル、2, 2-ジメチル-3- (5-ペンチルテトラヒドロキノリルオキシ) プロピオニル、5- (6-ヘキシルテトラヒドロキノリルオキシ) ペンタノイル、6- (7-メチルテトラヒドロキノリルオキシ) ヘキサノイル、2- (8-メチルテトラヒドロキノリルオキシ) アセチル、2- (1, 4-ジメチルテトラヒドロ

キノリルオキシ) アセチル、2- (2, 4, 6-トリメチルテトラヒドロキノリルオキシ) アセチル、2- (1-メチル-2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ) アセチル、3- (2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ) プロピオニル、4- (2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ) ブチリル、5- (2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ) ペンタノイル、6- (2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ) ヘキサノイル、2- (1, 6-ジメチル-2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ) アセチル基等のキノリン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ基が置換した炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

【0237】テトラヒドロナフチルオキシ低級アルカノイル基としては、例えば2-テトラヒドロナフチルオキシアセチル、3-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、2-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、4-テトラヒドロナフチルオキシブチリル、2, 2-ジメチル-3-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、5-テトラヒドロナフチルオキシペンタノイル、6-テトラヒドロナフチルオキシヘキサノイル基等のアルカノイル部分の炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるテトラヒドロナフチルオキシアルカノイル基を例示できる。

【0238】フェニル低級アルケニルカルボニル基としては、例えばシンナモイル、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル、3-フェニル-1-プロペニルカルボニル、4-フェニル-3-ブテニルカルボニル、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル、4-フェニル-1-ブテニルカルボニル、5-フェニル-4-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-3-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-2-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-1-ペンテニルカルボニル、1-メチル-3-フェニル-2-ブテニルカルボニル、1-メチルシンナモイル基等のアルケニルカルボニル部分が炭素数3~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルカルボニル基であるフェニルアルケニルカルボニル基を例示できる。

【0239】シクロアルケニル基としては、例えばシクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル基等の炭素数3~8のシクロアルケニル基を例示できる。

【0240】フェニル低級アルキルアミノカルボニル基としては、例えばベンジリアミノカルボニル、(2-フェニルエチル) アミノカルボニル、(1-フェニルエチル) アミノカルボニル、(3-フェニルプロピル) アミノカルボニル、(4-フェニルブチル) アミノカルボニル、(5-フェニルペンチル) アミノカルボニル、(6-フェニルヘキシル) アミノカルボニル、(1, 1-ジ

メチル-2-フェニルエチル) アミノカルボニル、(2-メチル-3-フェニルプロピル) アミノカルボニル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキルアミノカルボニル基を挙げることができる。

【0241】窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する飽和又は不飽和の5から11員環の単環又は二項環の複素環基としては、例えば、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、チオモルホリノ、ビリジル、ホモピペラジニル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロビリジル、チエニル、キノリル、1, 4-ジヒドロキノリル、ベンゾチアゾリル、ピラジル、ピリミジル、ピリダジル、ピロリル、カルボスチリル、3, 4-ジヒドロカルボスチリル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、インドリル、イソインドリル、インドリニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾリジニル、イソキノリル、キナゾリジニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、1, 2-ジヒドロイソキノリル、キノキサリニル、シンノリニル、フタラジニル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、クロマニル、イソインドリニル、イソクロマニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピラゾリジニル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、ベンゾフリル、2, 3-ジヒドロベンゾ〔b〕フリル、ベンゾチエニル、1-アザシクロヘプチル、4H-クロメニル、1H-インダゾリル、イソインドリニル、2-イミダゾリニル、2-ピロリニル、フリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラニル、ピラゾリジニル、2-ピラゾリニル、キヌクリジニル、1, 4-ベンゾオキサジニル、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾオキサジニル、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾチアジニル、1, 4-ベンゾチアジニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリニル、1, 3-ジチア-2, 4-ジヒドロナフタレニル、テトラヒドロ-1, 3-オキサジニル、テトラヒドロオキサゾリル、1, 4-ジチアナフタレニル基等を例示できる。

【0242】低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有する前記複素環としては、例えば1-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、2-オキソピペリジニル、2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、2-オキソピロリジニル、5-フェニルチアゾリル、1-メチルイミダゾリル、1-プロピルイミダゾリル、4-メチルイミダゾリル、4-フェニルイミダゾリル、1, 4-ジメチルピロリル、4-メチルピペラジニル、4-フェニルピペリジニル、4-メチルチアゾリル、2-オキソチアゾリル、5-エチルチアゾリル、4-フェニルチアゾリル、4-プロピルチアゾリル、5-ブチルチアゾリル、4-ベンチルチアゾリル、2-ヘキシルチアゾリル、4, 5-

-ジメチルチアゾリル、5-フェニル-4-メチルチアゾリル、1-エチルイミダゾリル、4-プロピルイミダゾリル、5-ブチルイミダゾリル、1-ベンチルイミダゾリル、1-ヘキシルイミダゾリル、1, 4-ジメチルイミダゾリル、1, 4, 5-トリメチルイミダゾリル、1-フェニルイミダゾリル、2-フェニルイミダゾリル、5-フェニルイミダゾリル、1-メチル-4-フェニルイミダゾリル、3-メチル-1, 2, 4-トリアゾリル、5-エチル-1, 2, 4-トリアゾリル、3-フェニル-1, 2, 4-トリアゾリル、2-オキソ-1-メチルイミダゾリル、2-オキソイミダゾリル、2-エチルピロリル、3-プロピルピロリル、5-ブチルピロリル、4-ベンチルピロリル、2-ヘキシルピロリル、2, 4, 5-トリメチルピロリル、2-フェニルピロリル、2, 5-ジフェニルピロリル、2-メチル-5-フェニルピロリル、2-オキソピロリル、1-メチル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-フェニル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-エチル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-プロピル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-ブチル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-ベンチル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-ヘキシル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-フェニル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、2-メチルピリジル、3-エチルピリジル、4-プロピルピリジル、2-ブチルピリジル、3-ベンチルピリジル、4-ヘキシルピリジル、2-フェニルピリジル、3-フェニルピリジル、4-フェニルピリジル、2, 4-ジメチルピリジル、2, 4, 6-トリメチルピリジル、2-メチル-4-フェニルピリジル、2, 4-ジフェニルピリジル、2, 4, 6-トリフェニルピリジル、2-オキソピリジル、4-オキソピリジル、4-メチル-2-オキソピリジル、2-フェニル-4-オキソピリジル、3-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、4-エチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、3-フェニルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、5-フェニルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、3-メチル-1H-インダゾリル、3-フェニル-1H-インダゾリル、1-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、5-エチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、1-オキソ-6-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、1-オキソ-7-フェニル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、3, 4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、3, 4, 5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ベンチルモルホリノ、4-ヘキシルピペラジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ベンチルモルホリノ、4-ヘキシルピペラジニル、3-メチルチオモルホリノ、4-フェニルピペラジニル、3-フェニルピロリジニル、2-オ-

キソ-4-メチルピペリジニル、2-オキソ-3-メチルピロリジニル、2-オキソ-4-フェニルピペリジニル、4-メチル-1-アザシクロヘプチル、5-フェニル-1-アザシクロヘプチル、6-メチル-2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、1-メチル-2-オキソイミダゾリジニル、1-イソブチル-2-オキソイミダゾリジニル、1-ベンジル-2-オキソイミダゾリジニル、2-オキソテトラヒドロ-1, 3-オキサジニル、3-フェニル-2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、2-オキソテトラヒドロオキサゾリル、3-クロロピリジル、4-メチルピペラジニル、4-イソブチルピペラジニル、4-メチルホモピペラジニル、4-アセチルピペラジニル、4-ベンジルピペラジニル、4-エチルホモピペラジニル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、フェニル基、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基、ハロゲン原子、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルであるフェニルアルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基を1～3個有する前記複素環基を例示できる。

【0243】シアノ置換低級アルキル基としては、例えばシアノメチル、2-シアノエチル、1-シアノエチル、3-シアノプロピル、4-シアノブチル、5-シアノペンチル、6-シアノヘキシル、1, 1-ジメチル-2-シアノエチル、2-メチル-3-シアノプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるシアノアルキル基を挙げることができる。

【0244】テトラゾリル基置換低級アルキル基としては、例えばテトラゾリルメチル、2-テトラゾリルエチル、1-テトラゾリルエチル、3-テトラゾリルプロピル、4-テトラゾリルブチル、5-テトラゾリルペンチル、6-テトラゾリルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-テトラゾリルエチル、2-メチル-3-テトラゾリルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるテトラゾリルアルキル基を例示できる。

【0245】低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基としては、例えばアセチルオキシメチル、2-プロピオニルオキシエチル、1-ブチルオキシエチル、3-アセチルオキシプロピル、4-アセチルオキシブチル、4-イソブチルオキシブチル、5-ペンタノイルオキシペンチル、6-アセチルオキシヘキシル、6-tert-ブチルカルボニルオキシヘキシル、1, 1-ジメチル-2-ヘキサノイルオキシエチル、2-メチル-3-アセチルオキシプロピル基等の炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基置換炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0246】置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチル

アミノ、イソブチルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基を例示できる。

【0247】ピリジル低級アルキル基としては、例えば(4-ピリジル)メチル、1-(3-ピリジル)エチル、2-(2-ピリジル)エチル、3-(2-ピリジル)プロピル、4-(3-ピリジル)ブチル、5-(4-ピリジル)ペンチル、6-(2-ピリジル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(3-ピリジル)エチル、2-メチル-3-(4-ピリジル)プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基を挙げることができる。

【0248】フェノキシ低級アルコキシカルボニル基としては、例えばフェノキシメトキシカルボニル、2-フェノキシエトキシカルボニル、1-フェノキシエトキシカルボニル、3-フェノキシプロポキシカルボニル、4-フェノキシブトキシカルボニル、5-フェノキシペンチルオキシカルボニル、6-フェノキシヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-フェノキシエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェノキシプロポキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフェノキシアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0249】ピリジル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば(4-ピリジル)メトキシカルボニル、(2-ピリジル)メトキシカルボニル、(3-ピリジル)メトキシカルボニル、2-(2-ピリジル)エトキシカルボニル、1-(1-ピリジル)エトキシカルボニル、3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル、4-(4-ピリジル)ブトキシカルボニル、5-(3-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル、6-(2-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-(4-ピリジル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル、基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるピリジルアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0250】フルオレニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば(5-フルオレニル)メトキシカルボニル、2-(2-フルオレニル)エトキシカルボニル、1-(1-フルオレニル)エトキシカルボニル、3-(3-フルオレニル)プロポキシカルボニル、4-(4-フルオレニル)ブトキシカルボニル、5-(5-フルオレニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(1-フルオレニル)ヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-(2-フルオレニル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(3-フルオレニル)プロポキシカルボニル

ニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフルオレニルアルコキシカルボニル基を例示できる。

【0251】低級アルケニルオキシカルボニル基としては、例えばビニルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル、2-ブテニルオキシカルボニル、3-ブテニルオキシカルボニル、1-メチルアリルオキシカルボニル、2-ペンテニルオキシカルボニル、2-ヘキセニルオキシカルボニル基等の炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルオキシカルボニル基を例示できる。

【0252】ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば(4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、2-(3-ピペリジニル)エトキシカルボニル、1-(2-ピペリジニル)エトキシカルボニル、3-(1-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(4-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(3-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(2-ピペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-(4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(1-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、(1-エチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、(1-t-ブトキシカルボニル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、(1-アセチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、2-(1-メチル-4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、1-(4-プロピル-1-ピペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-ブチル-3-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(3-ペンチル-2-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキシル-4-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、(1, 2-ジメチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、(3, 4, 5-トリメチル-1-ピペリジニル)メトキシカルボニル、2-(1-メトキシカルボニル-4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、1-(1-エトキシカルボニル-4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-プロポキシカルボニル-1-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(3-ペンチルオキシカルボニル-2-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキシルオキシカルボニル-4-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(4-メトキシカルボニル-1-ピペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、2-(2-アセチル-1-ピペリジニル)エトキシカルボニル、1-(3-プロピオニル-2-ピペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-ブチル-3-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(4-ペンタノイル-1-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキサノイル-4-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(1-アセチル-2-

メチル-4-ピペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、(1-エトキシカルボニル-2, 6-ジメチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル基等のピペリジン環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイル基、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるピペリジニルアルコキシカルボニル基を例示できる。

【0253】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基としては、例えばアミノスルホニルオキシ、メチルアミノスルホニルオキシ、エチルアミノスルホニルオキシ、プロピルアミノスルホニルオキシ、イソプロピルアミノスルホニルオキシ、ブチルアミノスルホニルオキシ、tert-ブチルアミノスルホニルオキシ、ペンチルアミノスルホニルオキシ、ヘキシルアミノスルホニルオキシ、ジメチルアミノスルホニルオキシ、ジエチルアミノスルホニルオキシ、ジプロピルアミノスルホニルオキシ、ジブチルアミノスルホニルオキシ、ジペンチルアミノスルホニルオキシ、ジヘキシルアミノスルホニルオキシ、N-メチル-N-エチルアミノスルホニルオキシ、N-エチル-N-プロピルアミノスルホニルオキシ、N-メチル-N-ブチルアミノスルホニルオキシ、N-メチル-N-ヘキシルアミノスルホニルオキシ等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノスルホニルオキシ基を例示できる。

【0254】フェニル低級アルキル基としては、例えばベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

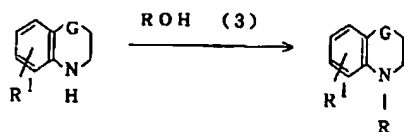
【0255】低級アルカノイル基置換アミノ基としては、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基置換アミノ基を例示できる。

【0256】本発明の化合物は、種々の方法により製造することができる。

【0257】

【化28】

反応式-1



【0258】<sup>2)</sup>式中、G、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、 $\text{R}^4$ 及びXは前記に同じ。]

反応式-1で示される方法は、一般式(2)のベンゾヘテロ環化合物と一般式(3)のカルボン酸とを、通常のアミド結合生成反応にて反応させる方法である。酸アミド結合生成反応には公知のアミド結合生成反応の条件を容易に適用できる。例えば(イ)混合酸無水物法、即ちカルボン酸(3)にアルキルハロ炭酸エステルを反応させて混合酸無水物とし、これにアミン(2)を反応させる方法、(ロ)活性エステル法、即ちカルボン酸(3)をp-ニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステルとし、これにアミン(2)を反応させる方法、(ハ)カルボジイミド法、即ちカルボン酸(3)にアミン(2)をジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存在下に縮合反応させる方法、(ニ)その他の方法、例えばカルボン酸(3)を無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン(2)を反応させる方法、カルボン酸(3)と低級アルコールとのエステルにアミン(2)を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸(3)の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法等を挙げることができる。

【0259】上記混合酸無水物法(イ)において用いられる混合酸無水物は、通常のショットテン-バウマン反応と同様の反応により得られ、これを通常単離することなくアミン(2)と反応させることにより一般式(1)の本発明化合物が製造される。上記ショットテン-バウマン反応は塩基性化合物の存在下に行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、ショットテン-バウマン反応に慣用の化合物例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1-メチル-2-ピロリジノン(NMP)、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基等が挙げられる。該反応は、通常-20~100℃程度、好ましくは0~50℃程度において行なわれ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~2時間程度である。得られた混合酸無水物とアミン(2)との反応は通常-20~150℃程度、好ま

しくは10~50℃程度において行なわれ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~5時間程度である。混合酸無水物法は一般に溶媒中に行なわれる。用いられる溶媒としては混合酸無水物法に慣用の溶媒がいずれも使用可能であり、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、p-クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒等又は之等の混合溶媒等が挙げられる。混合酸無水物法において使用されるアルキルハロ炭酸エステルとしては例えばクロロ蟻酸メチル、ブromo蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、ブromo蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。該法におけるカルボン酸(3)、アルキルハロ炭酸エステル及びアミン(2)の使用割合は、通常等モルずつとするのがよいが、アミン(2)に対してアルキルハロ炭酸エステル及びカルボン酸(3)はそれぞれ1~1.5倍モル量程度の範囲内で使用することができる。

【0260】また前記その他の方法(ニ)の内、カルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中に行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば上記ショットテン-バウマン反応に用いられる塩基性化合物の他に、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を例示できる。また用いられる溶媒としては、例えば上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、ピリジン、アセトン、水等を例示できる。アミン(2)とカルボン酸ハライドとの使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択でき、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~5倍モル量程度用いるのがよい。該反応は通常-20~180℃程度、好ましくは0~150℃程度にて行なわれ、一般に5分~30時間程度で反応は完結する。

【0261】更に上記反応式-1に示すアミド結合生成反応は、カルボン酸(3)とアミン(2)とを、フェニルホスフィン-2,2'-ジチオジピリジン、ジフェニルホスフィニルクロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリド、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド等のリン化合物の縮合剤の存在下に反応させる方法によっても実施できる。

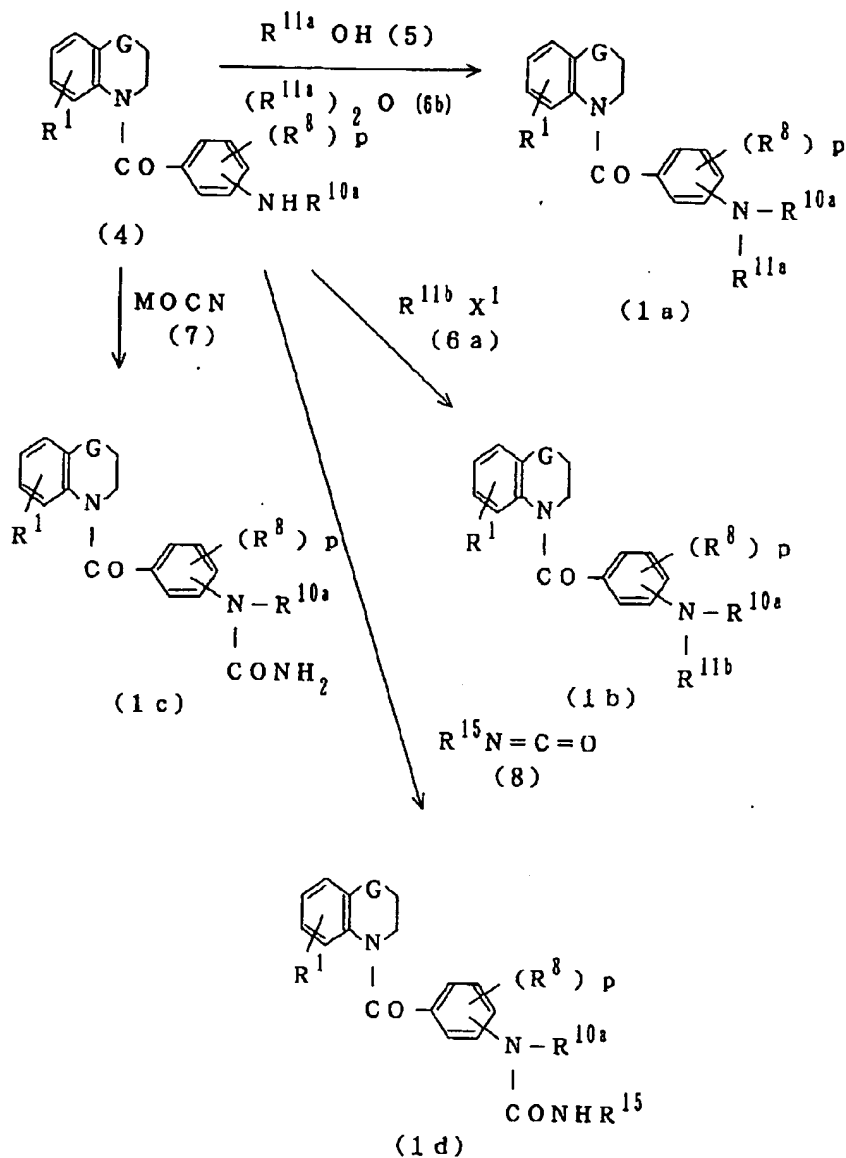
【0262】該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物の存在下に、通常-20~150℃程度、好ましくは0~100℃程度付近にて行なわれ、一般に5分~30時間程度にて反応は終了する。縮合剤及びカルボン

酸(3)の使用量はアミン(2)に対して夫々少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~2倍モル量程度使用するのがよい。

【0263】

【化29】

反応式-2



【0264】〔式中G、p、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>8</sup>及びXは前記に同じ。R<sup>10a</sup>は、水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R<sup>11a</sup>は、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル

基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、基

【0265】

### 【化30】

【0266】、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル低級アルケニルカルボニル基を示す。R<sup>1a</sup>は、低級アルキル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基又は低級アルキルスルホニル基を示す。X<sup>1</sup>はハロゲン原子を示す。Mはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。R<sup>15</sup>は低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基又はフェニル低級アルキル基を示す。]

化合物(4)と化合物(5)の反応は前記反応式-1の化合物(2)と化合物(3)の反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0267】化合物(4)と化合物(6a)の反応は、一般に適当な不活性溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下にて行なわれる。用いられる不活性溶媒としては例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール等の低級アルコール類、酢酸、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコール、ピリジン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基等を挙げることができる。化合物(4)と化合物(6a)との使用割合としては、特に限定がなく広い範囲で適宜選択すればよいが、前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～10倍モル量程度用いるのがよい。該反応は通常0～200℃程度、好ましくは0～170℃程度にて行なわれ、一般に30分～75時間程度で反応は終了する。該反応系内には沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物、銅粉等を添加してもよい。

【0268】化合物(4)と化合物(6b)の反応は、後記反応式-9における化合物(1t)と化合物(18)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0269】化合物(4)と化合物(7)との反応は、酸の存在下、適当な溶媒中に行なわれる。ここで使用される酸としては、例えば、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、塩酸、硫酸等の鉱酸等を挙げることができる。使用される溶媒としては、前記反応式-1のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。化合物(7)の使用量は、化合物(4)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～3倍モル量程度とするのがよい。該反応は、通常0～150℃、好ましくは室温～100℃付近にて行なわれ、通常10分～5時間程度にて反応は終了する。

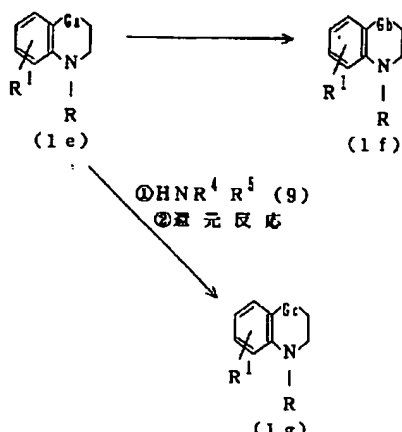
【0270】化合物(4)と化合物(8)との反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に、適当な溶媒中又は無溶媒下で行なわれる。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物は、前記反応式-1のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

【0271】化合物(8)の使用量としては、化合物(4)に対して通常等モル～5倍モル量程度、好ましくは等モル～3倍モル量程度とするのがよい。該反応は通常0～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度付近の温度で、通常5分～30時間程度を要して行なわれる。該反応には三弗化ほう素エチルエーテル等の硼素化合物を添加してもよい。

【0272】

【化31】

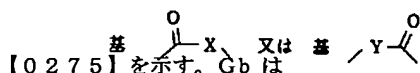
反応式-3



【0273】〔式中 $R^1$ 及び $R$ は前記に同じ。 $G_a$ は

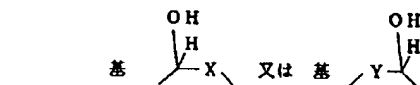
【0274】

【化32】



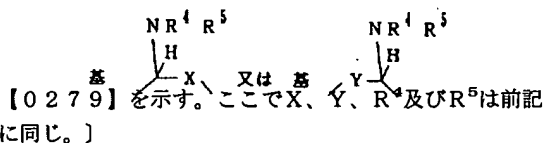
【0276】

【化33】



【0278】

【化34】



化合物(1e)を化合物(1f)に導く反応は還元反応により行ない得る。この還元反応には、水素化還元剤を用いる還元法が好適に利用される。用いられる水素化還元剤としては、例えば水素化アルミニウムリチウム、水素化硼素リチウム、水素化硼素ナトリウム、ジボラン等が挙げられ、その使用量は原料化合物に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～15倍モルの範囲である。この還元反応は、通常適当な溶媒、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグリム等のエーテル類やこれらの混合溶媒等を用い、通常約-60～150℃、好ましくは-30～100℃にて、約10分間～15時間程度で行なわれる。尚、還元剤として水素化アルミニウムリチウムやジボランを用いた場合は、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグ

ライム等の無水の溶媒を用いるのがよい。

【0280】化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、脱水剤の非存在下又は存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。脱水剤としては、例えばモレキュラーシーブ等の通常の溶媒の脱水に用いられる乾燥剤、塩酸、硫酸、三弗化ホウ素等の鉱酸、p-トルエンスルホン酸、酢酸等の有機酸等を挙げることができる。該反応は、通常室温～250℃、好ましくは50～200℃程度にて行なわれ、一般に1～48時間程度で反応は終了する。化合物(9)の使用量としては、特に制限されないが、通常化合物(1e)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量使用するのがよい。また脱水剤の使用量としては、乾燥剤の場合には通常大過剰量、酸を用いる場合には触媒量とするのがよい。

【0281】引き続き還元反応には、種々の方法が適用でき、適当な溶媒中触媒の存在下、接触水素添加することにより行ない得る。使用される溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒又は之等の混合溶媒等が挙げられる。また使用される触媒としては、例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネーニッケル等が挙げられる。触媒は、原料化合物に対して一般に0.02～1倍量程度用いるのがよい。反応温度は通常-20～100℃付近、好ましくは0～70℃付近、水素圧は通常1～10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5～20時間程度で終了する。

【0282】上記還元反応条件を利用できるが、好ましくは水素化還元剤を用いる還元法が好適に利用される。用いられる水素化還元剤としては、例えば水素化アルミニウムリチウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウム、ジボラン等が挙げられ、その使用量は、通常化合物(1e)に対して少なくとも0.1倍モル、好ましくは0.1倍モル～10倍モルの範囲である。この還元反応は、通常適当な溶媒、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル類、ジメチルホルムアミド又はこれらの混合溶媒等を用い、通常約-60～50℃、好まし

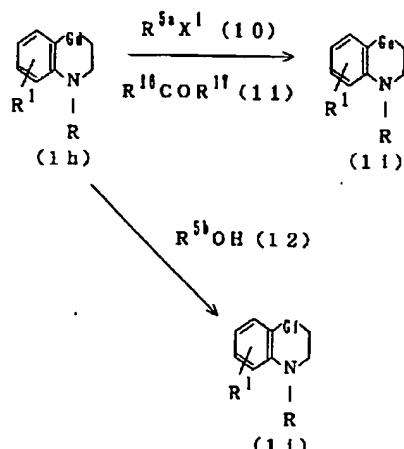


くは-30℃～室温にて、約10分間～5時間程度で行なわれる。なお、還元剤として水素化アルミニウムリチウムやジボランを用いた場合には、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジグライム等の無水の溶媒を用いるのがよい。

【0283】

【化35】

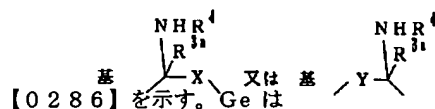
反応式-4



【0284】〔式中R<sup>1</sup>及びRは前記に同じ。R<sup>3a</sup>は水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。R<sup>5a</sup>は置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基を示す。R<sup>16</sup>及びR<sup>17</sup>はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。R<sup>5b</sup>は、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。Gdは

【0285】

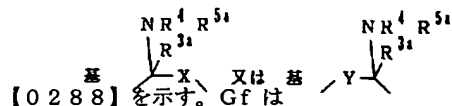
【化36】



【0286】を。Geは

【0287】

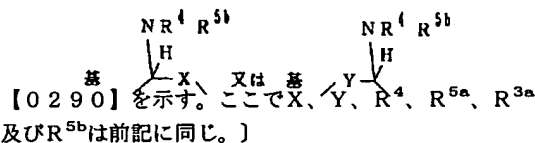
【化37】



【0288】を。Gfは

【0289】

【化38】



【0290】を。ここでX、Y、R<sup>4</sup>、R<sup>5a</sup>、R<sup>3a</sup>及びR<sup>5b</sup>は前記に同じ。]

化合物(1h)と化合物(10)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6)の反応と同

様の条件下に行なわれることができる。

【0291】化合物(1h)と化合物(11)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、アセトニトリル、ギ酸、酢酸、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライム、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、又は之等の混合溶媒を例示できる。還元剤としては例えばギ酸、ギ酸アンモニウム、ギ酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル等の接触還元剤等を例示できる。

【0292】還元剤としてギ酸を使用する場合、反応温度は通常室温～200℃程度、好ましくは50～150℃程度付近が適当であり、反応は1～10時間程度にて終了する。ギ酸の使用量は化合物(1h)に対して大過剰量使用するのがよい。

【0293】また水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常-30～100℃程度、好ましくは0～70℃程度が適当であり、30分～12時間程度で反応は完結する。還元剤の使用量は、化合物(1h)に対して通常等モル～20倍モル量程度、好ましくは1～6倍モル量程度とするのがよい。特に還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。

【0294】更に接触還元剤を用いる場合は、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又はギ酸、ギ酸アンモニウム、シクロヘキセン、抱水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30～100℃程度、好ましくは0～60℃程度の温度で反応を行なうのがよく、通常1～12時間程度で反応は終了する。接触還元剤の使用量としては化合物(1h)に対して通常0.1～40重量%、好ましくは1～20重量%程度とするのがよい。水素供与剤の使用量としては化合物(1h)に対して通常大過剰量とするのがよい。

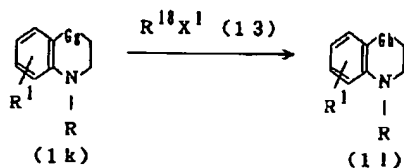
【0295】また化合物(11)の使用量としては化合物(1h)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量とするのがよい。

【0296】化合物(1h)と化合物(12)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の反応条件下に行ない得る。

【0297】

【化39】

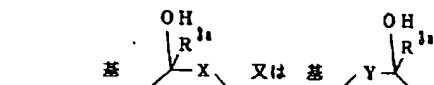
反応式-5



【0298】〔式中R<sup>1</sup>、R<sup>3a</sup>、R、X及びX<sup>1</sup>は、前記に同じ。G<sub>g</sub>は

【0299】

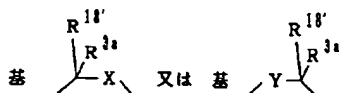
【化40】



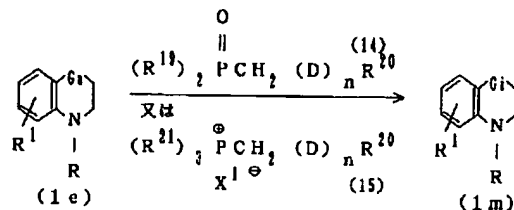
【0300】を示す。G<sub>h</sub>は

【0301】

【化41】



反応式-6



【0304】〔式中R<sup>1</sup>、R、X<sup>1</sup>及びG<sub>a</sub>は前記に同じ。G<sub>i</sub>は

【0305】

【化43】

【0306】を示す。X及びYは前記に同じ。R<sup>19</sup>は低級アルコキシ基を示す。R<sup>20</sup>は水素原子、低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ基又はフェニル基を示す。Dは低級アルキレン基を示す。nは0又は1を示す。R<sup>21</sup>はフェニル基を示す。]

化合物(1e)と化合物(14)又は(15)との反応は塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、金属ナトリウム、金属カリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウムt-ブトキシド等の金属アルコラート類、メチルリチウム、n-ブチルリチウム、フェニルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等のアルキル及びアリアルリチウム又

【0302】を示す。ここでX、Y及びR<sup>3a</sup>は前記に同じ。R<sup>18</sup>は、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は基-O-ACONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ。)を示す。R<sup>18</sup>は、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル基、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルキル基、カルボキシ基置換低級アルキル基又は基-ACONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(A、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ。)を示す。]

化合物(1k)と化合物(13)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0303】

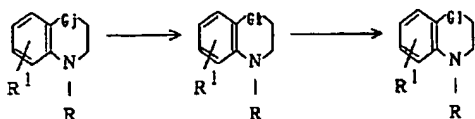
【化42】

はリチウムアミド類、ピリジン、ピペリジン、キノリン、トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン等の有機塩基等を例示できる。溶媒としては、反応に影響を与えないものであればいずれも使用できるが、例えばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、n-ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ピリジン、N、N-ジメチルアニリン等のアミン類、N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類等が挙げられる。反応温度は、通常-80~150℃、好ましくは-80~120℃付近とするのがよく、一般に0.5~15時間程度で反応は終了する。

【0307】

【化44】

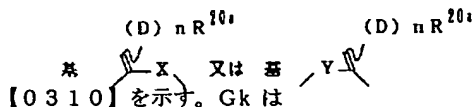
反応式-7



【0308】(式中 $R^1$ 及び $R$ は前記に同じ。 $G_j$ は)

【0309】

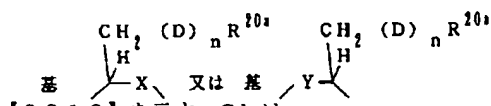
【化45】



【0310】を示す。 $G_k$ は

【0311】

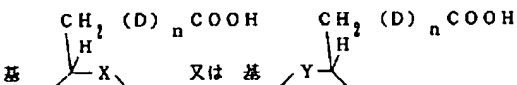
【化46】



【0312】を示す。 $G_l$ は

【0313】

【化47】



【0314】を示す。ここで $X$ 、 $Y$ 、 $D$ 及び $n$ は前記に同じ。 $R^{20a}$ は低級アルコキシカルボニル基を示す。]

化合物(1n)を化合物(1o)に導く反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を化合物(1g)に導く場合の還元反応条件と同様の条件下に行なわれる。該還元反応で水素還元剤を用いる還元法を利用するときには、該反応系内に塩化ニッケル等の金属ハロゲン化物を加えると反応は有利に進行する。

【0315】また金属マグネシウム-メタノールを用いて化合物(1n)を還元することによっても、化合物(1o)に導くことができる。この反応は、通常 $0\sim 50^\circ\text{C}$ 、好ましくは $0^\circ\text{C}$ ～室温付近にて行なわれ、一般に $1\sim 10$ 時間程度で反応は完結する。金属マグネシウムは、化合物(1n)に対して通常等モル～ $10$ 倍モル、好ましくは等モル～ $7$ 倍モル量使用するのがよい。 $X$ がメチレン基を示す化合物(1n)の場合には、上記反応条件下で $X$ がメチレン基である化合物(1o)に加えて、 $X$ が基 $=\text{CH}-$ である化合物も生成するが、これらの化合物は容易に分離され得る。

【0316】化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下に実施することができる。用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチル

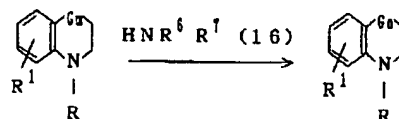
ケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸、ギ酸等の脂肪酸類、之等の混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金属水酸化物を挙げることができる。該反応は、通常室温～ $200^\circ\text{C}$ 程度、好ましくは室温～ $150^\circ\text{C}$ 程度にて好適に進行し、一般に $10$ 分～ $25$ 時間程度で終了する。

【0317】また化合物(1p)は、化合物(1o)を、適当な溶媒中、ジメチルスルフィド-塩化アルミニウム等のジアルキルスルフィド-ルイス酸の存在下に処理することによっても製造される。溶媒としては、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応で用いられる溶媒をいずれも使用できる。この処理は、通常 $0\sim 70^\circ\text{C}$ 、好ましくは $0\sim 50^\circ\text{C}$ 付近で、 $1\sim 10$ 時間行なえばよい。

【0318】

【化48】

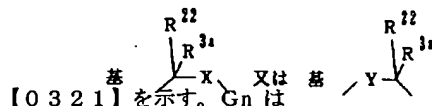
反応式-8



【0319】(式中 $R^1$ 及び $R$ は前記に同じ。 $G_k$ は)

【0320】

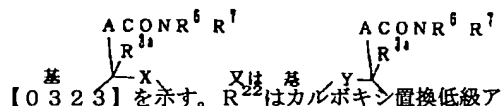
【化49】



【0321】を示す。 $G_n$ は

【0322】

【化50】



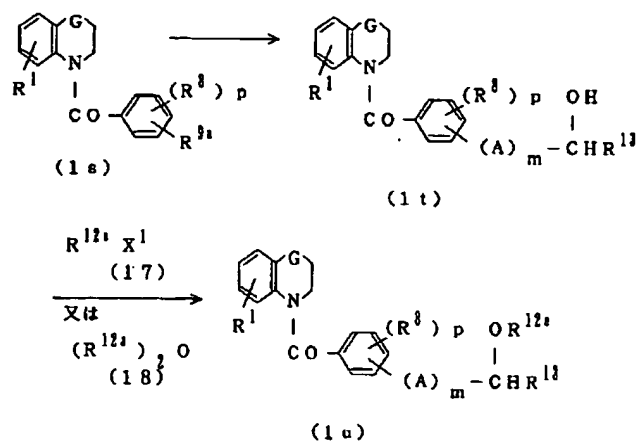
【0323】を示す。 $R^{22}$ はカルボキシル置換低級アルキル基を示す。 $R^{3a}$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $A$ 、 $X$ 及び $Y$ は前記に同じ。]

化合物(1q)と化合物(16)との反応は前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0324】

【化51】

反応式-9



【0325】〔式中G、p、R<sup>1</sup>、R<sup>8</sup>、X<sup>1</sup>、A、m及びR<sup>13</sup>は前記に同じ。R<sup>9a</sup>は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基を示す。R<sup>12a</sup>は低級アルカノイル基を示す。〕

化合物(1s)を化合物(1t)に導く反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を化合物(1f)に導く反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0326】化合物(1t)と化合物(17)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0327】化合物(1t)と化合物(18)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下もしくは非存在下、好ましくは存在下に行なわれる。ここで適当な溶媒としては例えば前述した芳香族炭化水素

類、メタノール、エタノール、プロパノール等の低級アルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の他、クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭化水素類、アセトン、ピリジン等を使用できる。塩基性化合物としては例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等を例示できる。上記反応はまた酢酸等の溶媒中、硫酸等の鉱酸の存在下を実施することもできる。

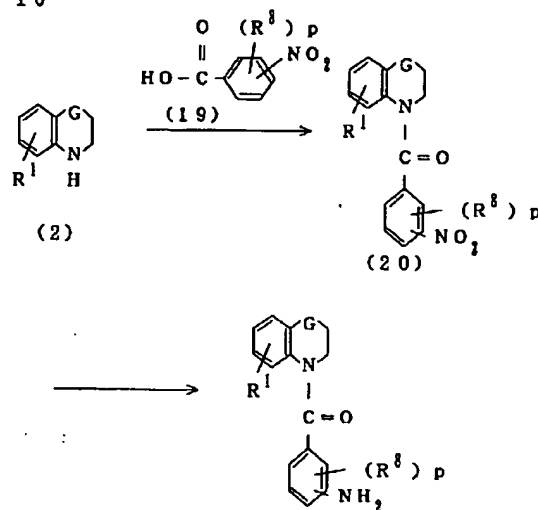
【0328】化合物(18)の使用割合は出発原料に対して等モル量〜大過剰量とすればよく、反応は通常0〜200℃程度、好ましくは0〜150℃程度下に、0.5〜20時間程度で完結する。

【0329】出発原料としての化合物(2a)は、例えば下記反応式により製造されることができる。

【0330】

【化52】

反応式-10



【0331】〔式中G、p、R¹及びR⁸は前記に同じ。〕

化合物(2)と化合物(19)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0332】化合物(20)を化合物(4)に導く反応は、例えば(1)適当な溶媒中接触還元触媒を用いて還元するか又は(2)適当な不活性溶媒中、金属もしくは金属塩と酸又は金属もしくは金属塩とアルカリ金属水酸化物、硫化物、アンモニウム塩等との混合物等を還元剤として用いて還元することにより行なわれる。

【0333】(1)の還元触媒を用いる場合、使用される溶媒としては例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、N、N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒等又はこれらの混合溶媒等が挙げられ、使用される接触還元触媒としては例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネーニッケル等が挙げられる。触媒は出発原料に対して一般に0.02~1倍量程度用い

る(4)がよい。反応温度は通常-20~150℃付近、好ましくは0~100℃付近、水素圧は通常1~10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5~10時間程度で終了する。また該反応には塩酸等の酸を添加してもよい。

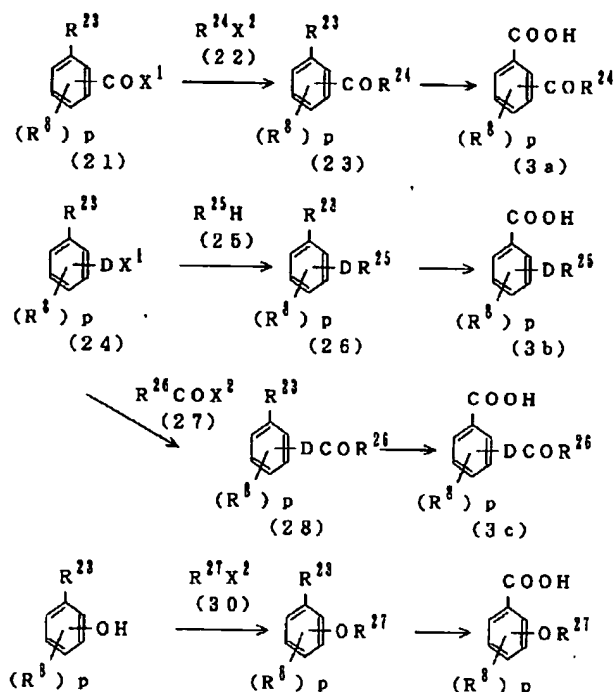
【0334】また(2)の方法を用いる場合、鉄、亜鉛、錫もしくは塩化第一錫と塩酸、硫酸等の鉱酸、又は鉄、硫酸第一鉄、亜鉛もしくは錫と水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物、硫化アンモニウム等の硫化物、アンモニア水、塩化アンモニウム等のアンモニウム塩との混合物が還元剤として用いられる。使用される不活性溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、ジオキサン等を例示できる。上記還元反応の条件としては、用いられる還元剤によって適宜選択すればよく、例えば塩化第一錫と塩酸とを還元剤として用いる場合、有利には0~80℃付近、0.5~10時間程度反応を行なうのがよい。還元剤は、原料化合物に対して少なくとも等モル量、通常は等モル~5倍モル量用いられる。

【0335】出発原料の(3)は例えば下記反応式により製造されることができる。

【0336】

【化53】

反応式-11



【0337】〔式中p、R<sup>8</sup>、D及びR<sup>23</sup>は前記に同じ。R<sup>24</sup>はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。X<sup>2</sup>はハロゲン原子を示す。R<sup>25</sup>は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ基を示す。R<sup>26</sup>は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基を示す。R<sup>27</sup>は、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基、又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルキル基を示す。〕

化合物(21)と化合物(22)との反応及び化合物(24)と化合物(27)との反応は、適当な溶媒中、亜鉛及び触媒の共存下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、1, 2-ジメトキシエタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。触媒としては、例えばテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム[Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]、酢酸パラジウム[Pd(OCOCH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]、塩化パラジウム[PdCl<sub>2</sub>]、ビストリフェニルホスフィンニッケルジクロリド[Ni(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>]等の様々なパラジウム化合物やニッケル化合物を例示できる。該反応は、通常

(31)0~70℃、好ましくは0~50℃付近にて行なわれ、一般に1~80時間程度にて終了する。

【0338】化合物(24)又は化合物(27)の使用量は、化合物(21)又は化合物(22)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル~2倍モル量程度とするのがよい。触媒の使用量としては、通常0.01倍~等モル程度、好ましくは0.03~0.3倍モル量程度とするのがよい。

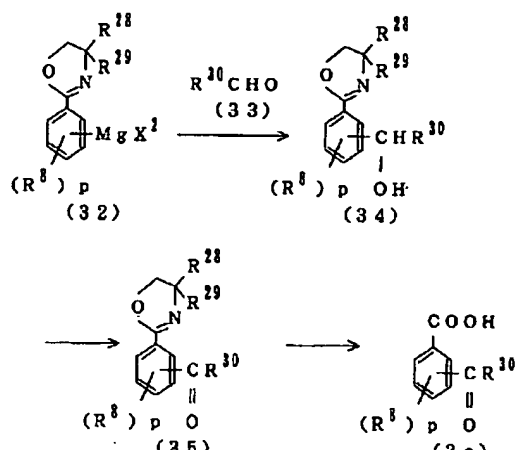
【0339】化合物(24)と化合物(25)との反応及び化合物(29)と化合物(30)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0340】化合物(23)、(26)、(28)又は(31)をそれぞれ化合物(3a)、(3b)、(3c)又は(3d)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0341】

【化54】

反応式-12



【0342】〔式中 $R^{28}$ 及び $R^{29}$ は、それぞれ低級アルキル基を示す。 $R^{30}$ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基を示す。 $p$ 、 $R^8$ 及び $X^2$ は前記に同じ。〕

化合物(32)と化合物(33)との反応は、適当な溶媒中で行なわれる。ここで使用される溶媒としては、グリニヤール反応で使用される溶媒ならいずれも使用可能であるが、例えばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の飽和炭化水素類等を好ましく例示できる。化合物(33)の使用量としては、化合物(32)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。上記反応は通常 $-70\sim 50^\circ\text{C}$ 、好ましくは $-30^\circ\text{C}$ ～室温付近にて行なわれ、一般に1～50時間程度で終了する。

【0343】化合物(34)を化合物(35)に導く反応は、適当な溶媒中、酸化剤の存在下に行なわれる。ここで使用される酸化剤としては、ピリジニウムクロクロメイト、ピリジニウムジクロクロメイト等のクロム酸ピリジニウム塩、ジメチルスルホキシド-オキサリルクロリド、重クロム酸、重クロム酸ナトリウム、重クロム酸カリウム等の重クロム酸塩、過マンガン酸、過マンガン酸カリウム、過マンガン酸ナトリウム等の過マンガン酸塩、二酸化マンガン、2, 3-ジクロロ-5, 6-ジシアノ-1, 4-ベンゾキノン(DDQ)等を例示できる。また使用される溶媒としては、例えば、水、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、メタノール、エタノール等のアルコール類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド又はこれらの混合溶媒を例示できる。酸化剤は、通常出発原料に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～2.5倍モル

量使用するのがよい。反応は、通常 $0\sim 100^\circ\text{C}$ 程度、好ましくは $0\sim 70^\circ\text{C}$ 程度にて行なわれ、一般に1～7時間程度にて終了する。

【0344】化合物(35)を化合物(3e)に導く反応は、適当な溶媒中、アルキル化剤の存在下に化合物(35)をアルキル化した後、得られる化合物を加水分解するか、又は化合物(35)を直接加水分解することにより行なわれる。

【0345】化合物(35)をアルキル化するに当り、使用されるアルキル化剤としては、沃化メチル等のハロゲン化アルキル等を例示できる。アルキル化は、通常室温～ $200^\circ\text{C}$ 、好ましくは室温～ $150^\circ\text{C}$ にて行なわれ、一般に1～30時間程度にて終了する。使用される溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド、アセトン、アセトニトリル、ニトロメタン等の極性溶媒を例示できる。アルキル化剤は、化合物(35)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～8倍モル量使用するのがよい。

【0346】引続き行なわれる加水分解反応には、通常の加水分解の反応条件をいずれも適用でき、具体的には例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウム等の塩基性化合物又は塩酸、硫酸等の鉱酸、酢酸等の有機酸等の存在下、水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸等の溶媒又はそれらの混合溶媒中にて行なわれる。該反応は、通常室温～ $200^\circ\text{C}$ 、好ましくは室温～ $150^\circ\text{C}$ 付近にて進行し、一般に0.5～20時間程度にて終了する。

【0347】化合物(35)を直接加水分解する反応も、上記加水分解条件と同様の条件下に行ない得る。この場合の反応時間は1～30時間程度とするのがよい。

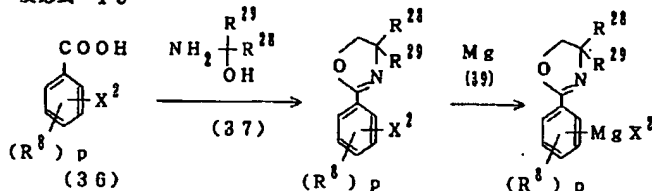
【0348】また化合物(35)を硫酸、塩酸、硝酸等の鉱酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等の存在下、上記加水分解と同様の溶媒、反応温度、反応時間にて加水分解することによっても化合物(3e)を得ることができる。

【0349】出発原料の化合物(32)は例えば下記反応式-13に示す方法で製造されることができる。

【0350】

【化55】

反応式-13



【0351】〔式中p、R<sup>8</sup>、R<sup>28</sup>、R<sup>29</sup>及びX<sup>2</sup>は前記に同じ。〕

化合物(36)と化合物(37)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応のうちカルボン酸ハライドを用いる方法と同様の条件下に行なわれることができる。化合物(37)の使用量としては化合物(36)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル〜2倍モル量とするのがよい。

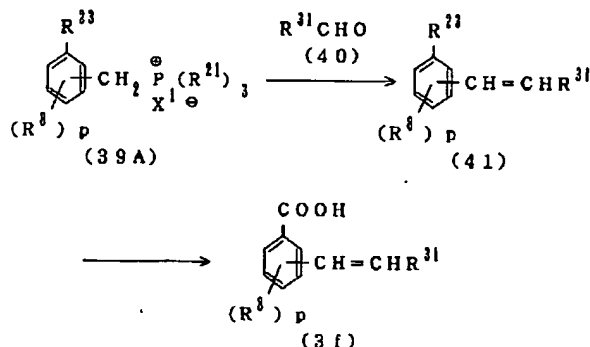
【0352】化合物(38)を化合物(39)との反応は、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジ

エーサン、モノグズ等、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、n-ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類等溶媒中、通常0〜150℃、好ましくは0〜100℃付近にて、0.5〜5時間程度反応させることにより行なうことができる。化合物(39)の使用量は化合物(38)に対して、少なくとも等モル、好ましくは等モル〜1.5倍モル量程度とするのがよい。

【0353】

【化56】

反応式-14



【0354】〔式中p、R<sup>8</sup>、R<sup>23</sup>、R<sup>21</sup>及びX<sup>1</sup>は前記に同じ。R<sup>31</sup>はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。〕

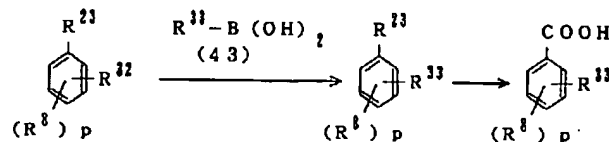
化合物(39A)と化合物(40)との反応は、前記反応式-6における化合物(1e)と化合物(14)又は(15)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0355】化合物(41)を化合物(3f)に導く反応は、前記反応式-6における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0356】

【化57】

反応式-15



【0357】〔式中p、R<sup>8</sup>及びR<sup>24</sup>は前記に同じ。R<sup>32</sup>はハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニルオキシ基又はハロゲン原子を示す。R<sup>33</sup>は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、フェニル基及び置換基として低級ア

ルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基を示す。〕

化合物(42)と化合物(43)との反応は、適当な溶媒中、リチウムクロリド等のリチウム化合物の存在下又は不存在下、塩基性化合物及び触媒の存在下で行なわれる。ここで使用される溶媒としては、前記反応式-13における化合物(38)と化合物(39)との反応で例



示された溶媒をいずれも使用することができる。塩基性化合物としては、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)の反応のうちカルボン酸ハライドを用いる方法で例示された塩基性化合物をいずれも使用することができる。触媒としては、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、塩化パラジウム等のパラジウム化合物を挙げることができる。該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行なわれ、一般に1～10時間程度にて終了する。塩基性化合物

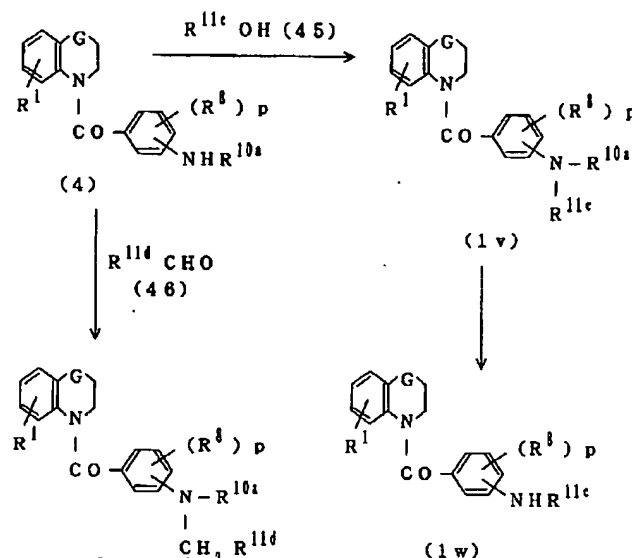
物及びリチウム化合物は、化合物(42)に対して、少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量使用するのがよい。また触媒は、触媒量使用するのがよい。

【0358】化合物(44)を化合物(3g)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0359】

【化58】

反応式-16



【0360】〔式中G、p、R<sup>1</sup>、R<sup>8</sup>及びR<sup>10a</sup>は前記に同じ。R<sup>11c</sup>は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、ベンゾイル低級アルキル基、又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基を示す。R<sup>11d</sup>は、前記R<sup>11c</sup>に加えて、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基を示す。〕化合物(4)と化合物(45)との反応は、例えばジエチルアゾジカルボキシレート、ジブチルアゾジカルボキシレート等のジアルキルアゾジカルボキシレート類、1, 1'-アゾジカルボニルジ(ピペリジン)等のジアルキルアゾジカルボキシアミド類及びトリアルキルホスフィン、トリアルキルホスフィン等のリン酸化合物の存在下に反応させることにより製造される。使用される溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。ジアルキルアゾジカルボキシレート類、リン酸化

物及び化合物(45)は、化合物(4)に対してそれぞれ少なくとも等モル程度、好ましくは1～3倍モル程度用いるのがよい。該反応は、通常-20～100℃、好ましくは-20～50℃にて進行し、一般に1～30時間で反応は終了する。

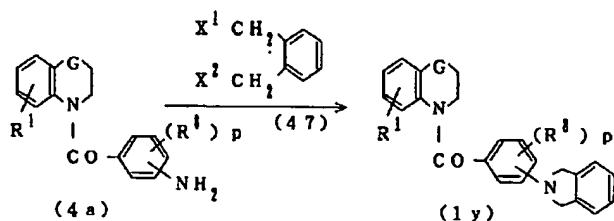
【0361】R<sup>10a</sup>が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す化合物(1v)の場合、該化合物を加水分解することにより、対応する化合物(1w)に導くことができる。この反応は、後記一般式(1)においてR<sup>9</sup>がフェニル環上に低級アルカノイルオキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物の加水分解反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0362】化合物(4)と化合物(46)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を(1g)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。化合物(46)の使用量は、化合物(4)に対して少なくとも等モル、好ましくは1～3倍モル量とするのがよい。

【0363】

【化59】

反応式-17



【0364】〔式中G、p、R<sup>1</sup>、R<sup>8</sup>、X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>は前記に同じ。〕

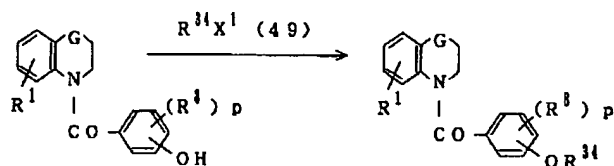
化合物(4a)と化合物(47)の反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同

様の条件下に行なわれることができる。

【0365】

【化60】

反応式-18



【0366】〔式中G、p、R<sup>1</sup>、R<sup>8</sup>及びX<sup>1</sup>は前記に同じ。R<sup>34</sup>は、低級アルキル基、低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有

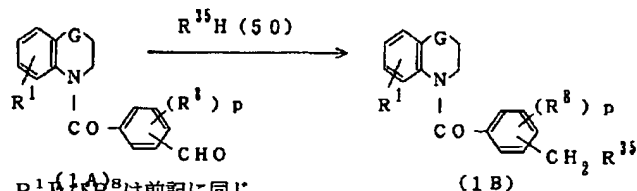
することのあるフェニル低級アルキル基、又はピロリジニル置換低級アルキル基を示す。〕

化合物(48)と化合物(49)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0367】

【化61】

反応式-19



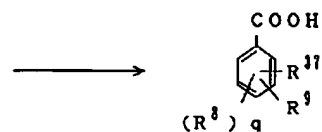
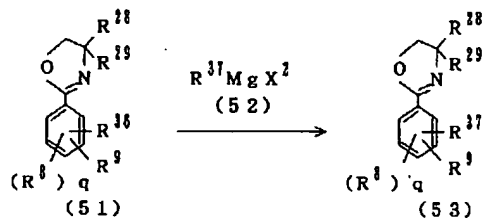
【0368】〔式中G、p、R<sup>1</sup>及びR<sup>8</sup>は前記に同じ。R<sup>35</sup>はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニノ基を示す。〕

化合物(1A)と化合物(50)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。化合物(50)の使用量は、化合物(1A)に対して、少なくとも等モル量、好ましくは等モル~5倍モル量とするのがよい。

【0369】

【化62】

反応式-20



【0370】〔式中R<sup>36</sup>は低級アルキル基又はハロゲン原子を示す。R<sup>37</sup>は低級アルキル基を示す。R<sup>8</sup>、R<sup>28</sup>、R<sup>29</sup>、R<sup>9</sup>及びX<sup>2</sup>は前記に同じ。qは0又は1を示

す。]

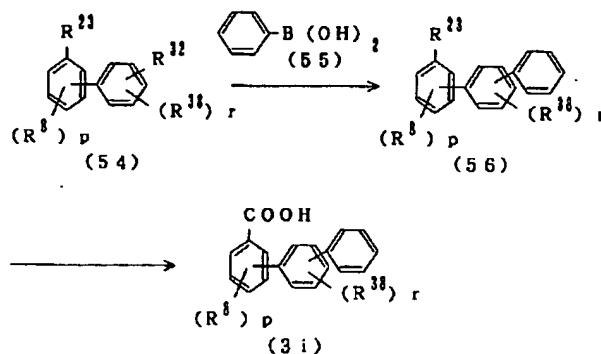
化合物(51)と化合物(52)との反応は、前記反応式-12における化合物(32)と化合物(33)の反応と同様の条件下にて行なわれる。化合物(52)の使

用量は化合物(51)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。

【0371】

【化63】

反応式-21



【0372】〔式中 $R^8$ 、 $p$ 、 $R^{32}$ 及び $R^{23}$ は前記に同じ。 $R^{38}$ は、低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基を示す。 $r$ は0、1又は2を示す。〕

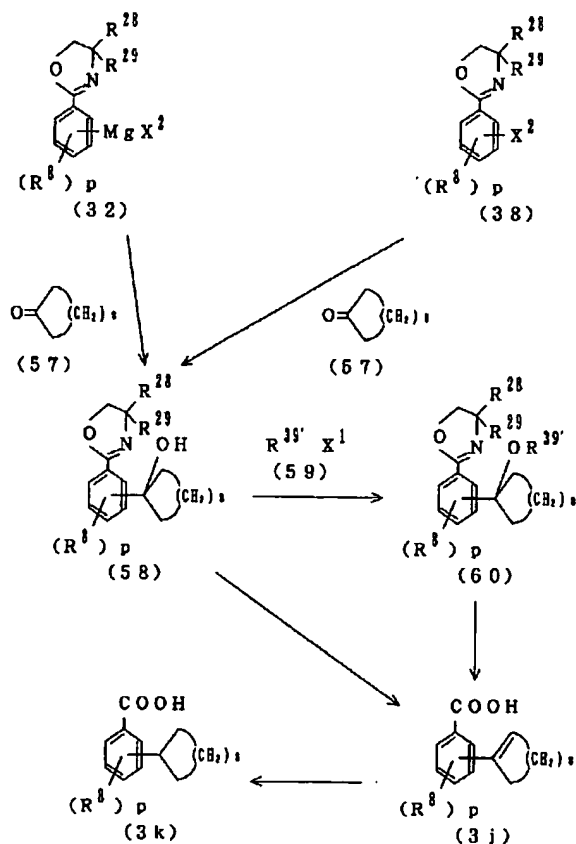
化合物(54)と化合物(55)との反応は、前記反応式-15における化合物(42)と化合物(43)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0373】化合物(56)を化合物(3i)に導く反応も、前記反応式-15の化合物(44)を化合物(3g)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0374】

【化64】

反応式-22



【0375】〔式中 $R^{28}$ 、 $R^{29}$ 、 $R^8$ 、 $p$ 、 $X^1$ 及び $X^2$ は前記に同じ。 $s$ は0～5の整数を示す。 $R^{39'}$ は低級アルキル基を示す。〕

化合物(32)と化合物(57)との反応は、前記反応式-12における化合物(32)と化合物(33)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0376】化合物(58)と化合物(59)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0377】化合物(38)と化合物(57)との反応は、前記反応式-6における化合物(1e)と化合物(14)又は化合物(15)との反応と同様の条件下に行なわれる。化合物(57)の使用量は、化合物(3

8)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～1.5倍モル量とするのがよい。

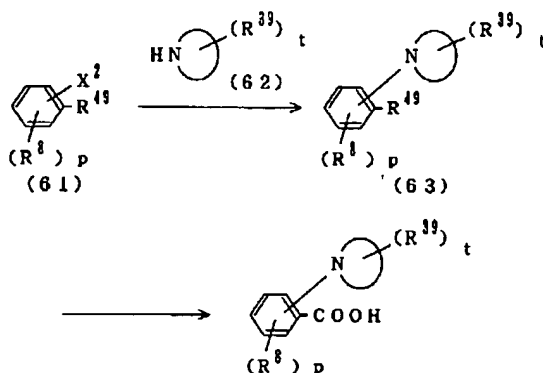
【0378】化合物(58)又は化合物(60)を化合物(3j)に導く反応は、反応時間が一般に1～50時間程度で終了する他は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0379】化合物(3j)を化合物(3k)に導く反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応中の接触水素添加する方法と同様の条件下に行なわれる。

【0380】

【化65】

反応式-23



【0381】〔式中 $R^8$ 、 $p$ 及び $X^2$ は前記に同じ。 $R^{39}$ は低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハゲン原子、フェニル低級アルキル基又はオキシ基を示す。 $t$ は0～3の整数を示す。 $R^{49}$ はシアノ基、低級アルコキシカルボニル基又はカルボキシ基を示す。基

【0382】

【化66】



【0383】は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和又は不飽和の5員～11員環の単環又

は二環の複素環基を示す。〕

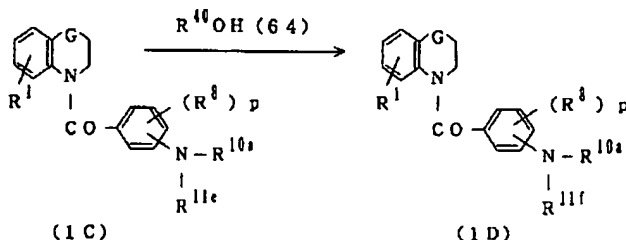
化合物(61)と化合物(62)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0384】 $R^{49}$ がシアノ基又は低級アルコキシカルボニル基である化合物(63)の場合、化合物(63)を化合物(3k)に導く反応は、前記反応式-7の化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0385】

【化67】

反応式-24



【0386】〔式中 $G$ 、 $R^1$ 、 $R^8$ 、 $p$ 及び $R^{10a}$ は前記に同じ。 $R^{11e}$ は、置換基としてハロゲン原子を有する低級アルカノイル基を示す。 $R^{40}$ は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキ

シ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基、ニトロ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基、低

級アルキル基、低級アルカノイル基、キノリル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリル基又はテトラヒドロナフチル基を示す。 $R^{11f}$ は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基、ニトロ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある

テトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基又はテトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基を示す。]

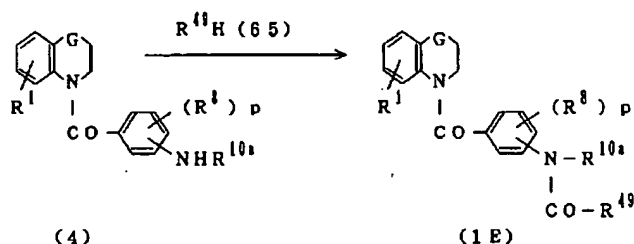
化合物(1C)と化合物(63)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0387】 $R^{11f}$ が低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基である化合物(1D)を前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に反応させて、対応する $R^{11f}$ が置換基として水酸基を有する低級アルカノイル基である化合物(1D)に導くことができる。

【0388】

【化68】

反応式-25



【0389】〔式中 $R^1$ 、 $G$ 、 $R^8$ 、 $p$ 及び $R^{10a}$ は前記に同じ。 $R^{49}$ はテトラヒドロイソキノリル基又は基

【0390】

【化69】

【0391】を示す。]

化合物(4)を化合物(1E)に導く反応は、(1)適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に化合物(4)とカルボニル化剤とを反応させた後、次いで(2)適当な溶媒中、上記で得られる反応生成物を塩基性化合物の存在下化合物(65)と反応させることにより実施される。

【0392】(1)の反応において、使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応式-1のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。使用されるカルボニル化剤としては、カルボニルジイミダゾール、ホスゲン、ダイホスゲン、尿素、トリホスゲン等を例示できる。カルボニル化剤の使用量は、化合物(4)に対して、通常0.05~等モル、好ましくは0.1~等モル量とするのがよい。該反応は、通常0~200℃、好ましくは0~180℃付近にて、1~10時間程度にて終了する。

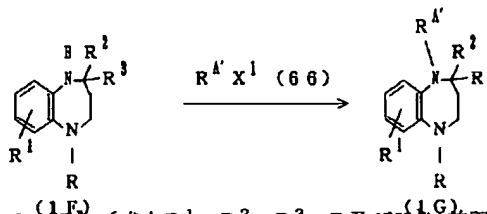
【0393】(2)の反応において、使用される溶媒及び塩基性化合物は、前記(1)の反応で用いた溶媒及び塩基

性化合物をいずれも使用することができる。また(1)と(2)の反応は、分離することなくワンポットで行うこともできる。化合物(65)の使用量は、化合物(4)に対して通常等モル~5倍モル、好ましくは等モル~3モル量とするのがよい。該反応は通常室温~150℃、好ましくは、室温~120℃付近にて、0.5~5時間程度にて終了する。

【0394】

【化70】

反応式-26



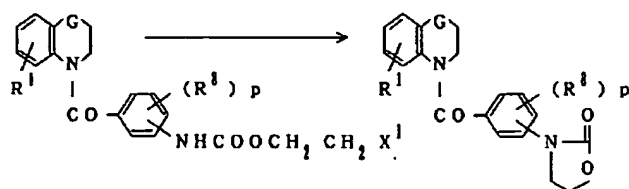
【0395】〔式中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R$ 及び $X^1$ は前記に同じ。 $R^4$ は水素原子以外の $R^4$ を示す。]

化合物(1F)と化合物(66)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0396】

【化71】

反応式-27



【0397】〔式中 $R^1$ 、 $G$ 、 $R^8$ 、 $p$ 及び $X^1$ は前記に同じ。〕

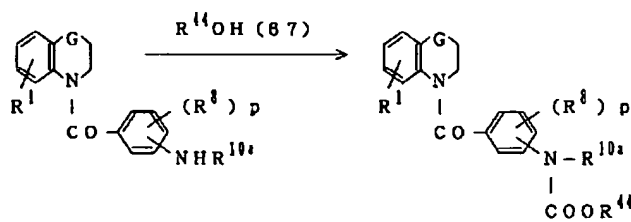
化合物(1H)を化合物(1I)に導く反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反

応と同様の条件下に行なわれる。

【0398】

【化72】

反応式-28



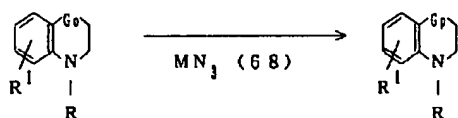
【0399】〔式中 $R^1$ 、 $G$ 、 $R^8$ 、 $p$ 及び $R^{10a}$ は前記に同じ。 $R^{44}$ は、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェノキシ低級アルキル基、フェニル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基、フルオレニル低級アルキル基、低級アルケニル基又はピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルキル基を示す。〕

化合物(4)と化合物(67)との反応は、前記反応式-25における化合物(4)を化合物(1E)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0400】

【化73】

反応式-29



【0401】〔式中 $R^1$ 及び $R$ は前記に同じ。 $G$ は

【0402】

【化74】

【0403】 $R^{3a}R^{45}$ を $X$ 、又は $R^{3a}R^{45}$ を $Y$

【0404】 $Gp$ は

【0405】

【0406】 $R^{3a}R^{45}$ を $X$ 、又は $R^{3a}R^{45}$ を $Y$ を示す。ここで $R^{45}$ はシアノ置換低級アルキル基を示す。 $R^{46}$ はテトラゾリル基置換低級アルキル基を示す。 $M$ はナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。〕

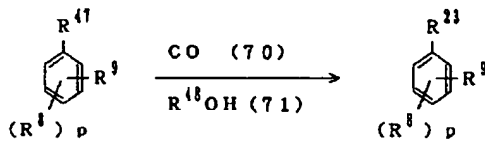
化合物(1K)を化合物(1L)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に化合物(1K)を化合物(68)と反応させることにより行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、 $N$ -メチルピロリドン、無水酢酸、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチリン酸トリアミド等の極性溶媒等を例示できる。ここで使用される塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、金属ナトリウム、金属カリウム、ナトリウムアミド等の無機塩基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアニリン、ピペリジン、ピリジン、トリエチルアミン、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の有機塩基等を例示できる。化合物(6

8)の使用量は、化合物(1K)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～5倍モル量とするのがよい。該反応は通常室温～200℃、好ましくは50～150℃付近にて、1～40時間程度にて終了する。

【0407】

【化76】

反応式-30



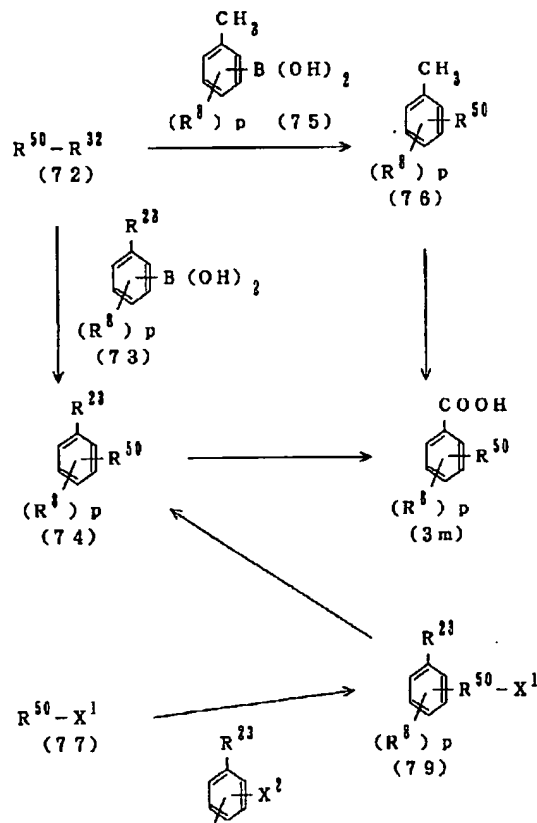
【0408】(式中R<sup>8</sup>、p、R<sup>9</sup>及びR<sup>23</sup>は前記に同じ。R<sup>47</sup>はハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニルオキシ基を示す。R<sup>48</sup>は低級アルキル基を示す。)

化合物(69)、一酸化炭素(70)及び化合物(71)の反応は、適当な溶媒中触媒及び塩基性化合物の存在下反応させることにより行なわれる。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)の反応の内、カルボン酸ハライドを用いる方法で例示された溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。触媒としては、酢酸パラジウム、1,3-ビス(ジフェニルフォスフィノ)プロパン(dppp)等を例示できる。該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて、1～10時間程度に終了する。化合物(70)、化合物(71)及び触媒は、化合物(69)に対して通常それぞれ大過剰量使用するのがよい。

【0409】

【化77】

反応式-31



【0410】〔式中R<sup>50</sup>は窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい。)を示す。R<sup>32</sup>、R<sup>23</sup>、R<sup>8</sup>、p、X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>は前

(76)に同じ。〕

化合物(72)と化合物(73)との反応は、前記反応式-21における化合物(54)と化合物(55)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0411】化合物(74)を化合物(3m)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0412】化合物(72)と化合物(75)との反応は、前記反応式-21における化合物(54)と化合物(55)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0413】化合物(76)を化合物(3m)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は不存在下及び酸化剤の存在下に行われる。ここで使用される溶媒及び酸化剤は、前記反応式-12における化合物(34)を化合物(35)に導く反応と同様の溶媒、酸化剤を例示できる。酸化剤の使用量は、化合物(76)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～4倍モル量とするのがよい。また使用される塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等を例示できる。該反応は、通常0～150℃程度、好ましくは0～120℃程度にて行われ、一般に1～7時間程度で終了する。

【0414】化合物(77)から化合物(79)を導く反応は、化合物(77)を適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下、通常-80～50℃、好ましくは-80℃～室温付近にて一般に0.5～5時間程度処理した後、同様の溶媒中、亜鉛、塩化亜鉛等の亜鉛化合物、触媒及び塩基性化合物の存在下、化合物(78)を反応させることにより行われる。化合物(77)の処理時に使用される塩基性化合物としては、例えばメチルリチウム、n-ブチルリチウム、フェニルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等のアルキル及びアリールリチウム又はリチウムアミド類等が挙げられる。また化合物(78)との反応時に使用される塩基性化合物としては、ジイソプロピルエチルアミンに加えて、前記反応式-1における化合物(3)のカルボン酸ハライドとアミン(2)との反応で用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。化合物(77)の処理時及び化合物(78)との反応時の塩基性化合物の使用量は、化合物(77)

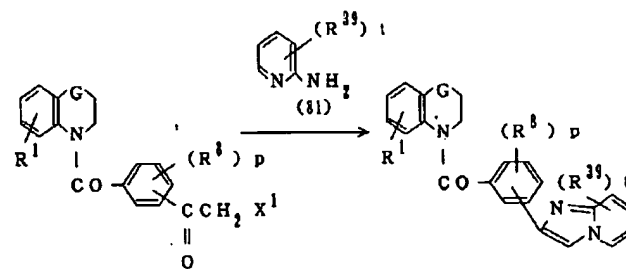
に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。また亜鉛化合物の使用量は、化合物(77)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。使用される溶媒及び触媒、並びに触媒、化合物(77)及び化合物(78)の使用量は、前記反応式-11における化合物(21)と化合物(22)との反応と同様の反応条件下に行われる。該反応は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃付近にて行われ、一般に1～10時間程度で終了する。

【0415】化合物(79)を化合物(74)に導く反応は、適当な溶媒中、接触還元触媒を用いて還元することにより行われる。使用される溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、N、N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。また使用される接触還元触媒としては、例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネーニッケル等が挙げられる。斯かる触媒は、出発原料に対して一般に0.02～1倍量程度用いるのがよい。また該反応の反応系内には酢酸ナトリウム等を添加してもよい。反応温度は通常-20～150℃付近、好ましくは0～100℃付近、水素圧は通常1～10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5～10時間程度で終了する。

【0416】

【化78】

反応式-32



【0417】〔式中、R<sup>1</sup>、G、(8a)、p、X<sup>1</sup>、R<sup>39</sup>及びtは前記に同じ。〕

化合物(80)と化合物(81)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応

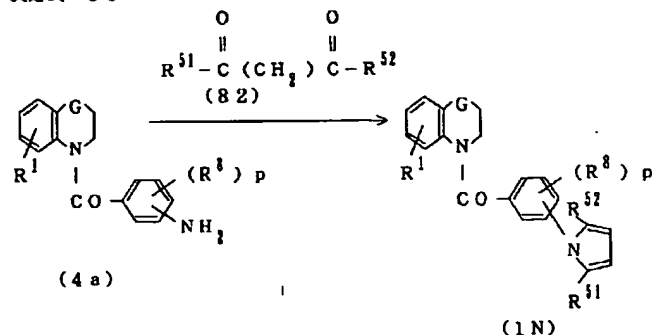
と同様の反応条件下に行われる。

【0418】

【化79】



反応式-33



【0419】〔式中、 $R^1$ 、 $G$ 、 $R^8$ 及び $p$ は前記に同じ。 $R^{51}$ 及び $R^{52}$ はそれぞれ低級アルキル基を示す。〕化合物(4a)と化合物(82)との反応は、適当な溶媒中、酸の存在下に行なうことができる。ここで使用される溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸、ギ酸等の脂肪酸、これらの混合溶媒等が挙げられる。また使用される酸としては、例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸、ギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等が挙げられる。化合物(82)の使用量は、化合物(4a)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。該反応は通常室温～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、一般に0.5～5時間程度で終了する。

【0420】上記一般式(1)において、 $R^1$ が水酸基である化合物は、対応する $R^1$ が低級アルコキシ基である化合物を脱アルキル化反応させることにより得ることもできる。この脱アルキル化反応は適当な溶媒中酸の存在下に行なわれる。溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等の低級アルコール類、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等の極性溶媒、酢酸等の有機酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸類、三弗化ホウ素、塩化アルミニウム、三臭化ホウ素等のルイス酸、沃化ナトリウム、沃化カリウム等の沃化物、上記ルイス酸と沃化物の混合物等を挙げることができる。該反応は通常室温～150℃、好ましくは室温～120℃にて好適に進行し、一般に0.5～15時間程度で終了する。

【0421】上記一般式(1)において、 $R^9$ がフェニル環上にフェニル低級アルコキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物の場合、この化合物を接触還元することにより対応する $R^9$ がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物に導

くことができる。該接触還元は、適当な溶媒中還元剤の存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、酢酸、酢酸エチル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類等又はこれらの混合溶媒等を例示できる。還元剤としては、パラジウム黒、パラジウム炭素、酸化白金、白金黒、白金炭素、ラネーニッケル等の接触還元触媒を用いることができる。該反応は、通常常圧～20気圧、好ましくは常圧～10気圧の水素雰囲気中、通常-30～100℃、好ましくは0～60℃の温度で行なわれる。触媒の使用量としては、原料化合物に対して通常0.1～40重量%、好ましくは0.1～20重量%とするのがよい。

【0422】上記一般式(1)において、 $R^9$ がフェニル環上に低級アルカノイルオキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物又は $R^9$ が低級アルカノイルオキシ基を示す化合物である場合、これらの化合物を加水分解することにより対応する $R^9$ がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物又は $R^9$ が水酸基を示す化合物に導くことができる。この加水分解は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下に行なうことができる。用いられる溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、ギ酸、酢酸等の脂肪酸類、及びこれらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。該反応は通常室温～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、一般に0.5～25時間程度で終了する。

【0423】上記一般式(1)において、 $R^9$ が低級ア

ルコキシ基である化合物の場合、この化合物を脱アルキル化反応させることにより対応する $R^9$ が水酸基である化合物に導くことができる。また $R^9$ がフェニル環上に低級アルコキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物(1)の場合も、同様に脱アルキル化反応させることにより、対応する $R^9$ がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基である化合物に導くことができる。この脱アルキル化反応は、適当な溶媒中酸の存在下にて行なわれる。溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等の低級アルコール類、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等の極性溶媒、酢酸等の有機酸、又はこれらの混合溶媒を挙げることができる。酸としては例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸類、三弗化ホウ素、塩化アルミニウム、三臭化ホウ素等のルイス酸、沃化ナトリウム、沃化カリウム等の沃化物、上記ルイス酸と沃化物の混合物等を挙げることができる。該反応は通常室温 $\sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは室温 $\sim 120^{\circ}\text{C}$ にて好適に進行し、一般に0.5 $\sim 15$ 時間程度で終了する。

【0424】一般式(1)の化合物において、 $R^{11}$ がフェニル環上に置換基としてアミノ基を少なくとも一つ有するフェノキシ低級アルカノイル基を示す化合物である場合、この化合物と一般式 $R^{41}X^1$ (10a)(式中、 $R^{41}$ は低級アルキル基を示す。 $X^1$ は前記に同じ。)で表わされる化合物又は一般式 $R^{16}COR^{17}$ (11)(式中、 $R^{16}$ 及び $R^{17}$ は前記に同じ。)で表わされる化合物とを、反応式-4における化合物(1h)と化合物(10)又は化合物(11)の反応と同様の条件下に反応させて、対応する $R^{11}$ がフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有するアミノ基を少なくとも一つ有するフェノキシ低級アルカノイル基である化合物に導くことができる。

【0425】一般式(1)の化合物において、 $R^9$ が置換又は未置換の窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1 $\sim 4$ 個有する飽和又は不飽和の5員 $\sim 11$ 員環の単環又は二項環の複素環基であって、その複素環基が骨格に二級のアミノ基を有している化合物の場合、この化合物を一般式 $R^{42}X$ (10b)(式中、 $X$ は前記に同じ。 $R^{42}$ は低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)で表わされる化合物又は一般式 $R^{16}COR^{17}$ (11)(式中、 $R^{16}$ 及び $R^{17}$ は前記に同じ)で表わされる化合物と、反応式-4における化合物(1h)と化合物(10)又は化合物(11)との反応と同様の条件下に反応させて、対応する $R^9$ の複素環残基の二級のアミノ基に、低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又は低級アルカノイル基が置換した複素環残基を有する化合物に導くことができる。また、一般式 $R^{43}OH$ (12a)( $R^{43}$ は低級アルカノイル基を示

す。)で表わされる化合物とを、反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に反応させて、対応する $R^9$ の複素環残基の二級のアミノ基に低級アルカノイル基が置換した複素環残基を有する化合物に導くことができる。

【0426】本発明の化合物(1)の内、酸性基を有する化合物は、薬理的に許容し得る塩基性化合物と塩を形成し得る。かかる塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩又は重炭酸塩、ナトリウムメチラート、カリウムエチラート等のアルカリ金属アルコラート等を例示することができる。また、本発明の化合物(1)中、塩基性を有する化合物は、通常薬理的に許容される酸と容易に塩を形成し得る。かかる酸としては、例えば硫酸、硝酸、塩酸、臭化水素酸等の無機酸、酢酸、p-トルエンスルホン酸、エタンスルホン酸、シユウ酸、マレイン酸、フマル酸、クエン酸、コハク酸、安息香酸等の有機酸を例示できる。之等の塩もまた遊離形態の化合物(1)と同様に本発明において有効成分化合物として用いることができる。尚、上記化合物(1)には、立体異性体、光学異性体が包含されるが、之等も同様に有効成分化合物として用いることができる。

【0427】上記各反応式に示される方法により得られる目的とする化合物は、通常分離手段により反応系内より分離され、更に精製することができる。この分離及び精製手段としては、例えば蒸留法、再結晶法、カラムクロマトグラフィー、イオン交換クロマトグラフィー、ゲルクロマトグラフィー、親和クロマトグラフィー、プレパラティブ薄層クロマトグラフィー、溶媒抽出法等を採用できる。

【0428】かくして得られる有効成分化合物は、パソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤及びパソプレシン作動剤として有効であり、該これら薬剤は、一般的な医薬製剤の形態で用いられる。製剤は通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。この医薬製剤としては各種の形態が治療目的に応じて選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤(液剤、懸濁剤等)等が挙げられる。錠剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来よりよく知られている各種のものを広く使用することができる。その例としては、例えば乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カリシウム、カオリン、結晶セルロース、ケイ酸等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピ

ロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、カンテン末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等を使用できる。さらに錠剤は必要に応じ通常の剤皮を施した錠剤、例えば糖衣錠、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。丸剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用できる。その例としては、例えばブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、カンテン等の崩壊剤等を使用できる。坐剤の形態に成形するに際しては、担体として従来公知のものを広く使用できる。その例としては、例えばポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等を挙げることができる。カプセル剤は常法に従い通常有効成分化合物を上記で例示した各種の担体と混合して硬質ゼラチンカプセル、軟質カプセル等に充填して調製される。注射剤として調製される場合、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、且つ血液と等張であるのが好ましく、これらの形態に成形するに際しては、希釈剤としてこの分野において慣用されているものをすべて使用でき、例えば水、エチルアルコール、マクロゴール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチ

レンソルビタン脂肪酸エステル類等を使用できる。なお、この場合等張性の溶液を調製するに充分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有せしめてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を添加してもよい。更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を医薬製剤中に含有させることもできる。

【0429】本発明の医薬製剤中に含有されるべき有効成分化合物の量としては、特に限定されず広範囲から適宜選択されるが、通常製剤組成物中に約1～70重量%、好ましくは約5～50重量%とするのがよい。

【0430】本発明の医薬製剤の投与方法は特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等に応じた方法で投与される。例えば錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には、経口投与される。また注射剤の場合には単独で又はブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内投与され、更に必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内投与される。坐剤の場合には直腸内投与される。

【0431】本発明医薬製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等により適宜選択されるが、通常有効成分化合物の量が、1日当たり体重1kg当り、約0.6～50mg程度とするのが良い。また投与単位形態の製剤中には有効成分化合物が約10～1000mgの範囲で含有されるのが望ましい。

【0432】

【実施例】以下、本発明を更に詳細に説明するため、本発明医薬製剤の製剤例を挙げ、次いで該製剤に配合される有効成分化合物の製造のための原料化合物の製造例を参考例として、また上記有効成分化合物の製造例を実施例として挙げ、更に有効成分化合物の試験例を挙げる。

【0433】製剤例1

7-クロロ-5-〔(4-エチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル〕-1-〔2-メトキシ-4-(2-メチルフェニル)ベンゾイル〕-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン	150g
アピセル(商標名、旭化成社製)	40g
コーンスターチ	30g
ステアリン酸マグネシウム	2g
ヒドロキシプロピルメチルセルロース	10g
ポリエチレングリコール-6000	3g
ヒマシ油	40g
エタノール	40g

本発明有効成分化合物、アピセル、コーンスターチ及びステアリン酸マグネシウムを混合研磨後、糖衣R10mmのキネで打錠する。得られた錠剤をヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリエチレングリコール-600

0、ヒマシ油及びエタノールからなるフィルムコーティング剤で被覆を行ない、フィルムコーティング錠を製造する。

【0434】製剤例2

7-クロロ-5-〔(N-(2-ジエチルアミノエチル)-N-メチルアミノ)カルボニルメチル〕-1-(3,4-ジメトキシベン

ゾイル) - 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン	150 g
クエン酸	1.0 g
ラクトース	33.5 g
リン酸ニカルシウム	70.0 g
ブルロニックF-68	30.0 g
ラウリル硫酸ナトリウム	15.0 g
ポリビニルピロリドン	15.0 g
ポリエチレングリコール (カルボワックス1500)	4.5 g
ポリエチレングリコール (カルボワックス6000)	45.0 g
コーンスターチ	30.0 g
乾燥ステアリン酸ナトリウム	3.0 g
乾燥ステアリン酸マグネシウム	3.0 g
エタノール	適量

本発明有効成分化合物、クエン酸、ラクトース、リン酸ニカルシウム、ブルロニックF-68及びラウリル硫酸ナトリウムを混合する。

【0435】上記混合物をNo. 60スクリーンでふるい、ポリビニルピロリドン、カルボワックス1500及び同6000を含むアルコール製溶液で湿式粒状化する。必要に応じてアルコールを添加して粉末をペースト状塊にする。コーンスターチを添加し、均一な粒子が形成されるまで混合を続ける。混合物をNo. 10スクリーンを通過させ、トレイに入れ、100℃のオーブンで12～14時間乾燥する。乾燥粒子をNo. 16スクリ

7-クロロ-5-〔(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-〔2-メトキシ-4-(2,4-ジクロロベンジルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン	5 g
ポリエチレングリコール (分子量: 4000)	0.3 g
塩化ナトリウム	0.9 g
ポリオキシエチレン-ソルビタンモノオレエート	0.4 g
メタ重亜硫酸ナトリウム	0.1 g
メチル-パラベン	0.18 g
プロピル-パラベン	0.02 g
注射用蒸留水	10.0 ml

上記パラベン類、メタ重亜硫酸ナトリウム及び塩化ナトリウムを攪拌しながら80℃で上記の約半量の蒸留水に溶解させる。得られた溶液を40℃まで冷却し、本発明の有効成分化合物、次いでポリエチレングリコール及びポリオキシエチレンソルビタンモノオレエートを、上記溶液中に溶解させる。次にその溶液に注射用蒸留水を加えて最終の容量に調製し、適当なフィルターペーパーを用いて滅菌濾過することにより滅菌して、注射剤を調製する。

#### 【0438】参考例1

4-クロロメチル安息香酸メチルエステル26.36gを1,2-ジメトキシエタン700mlに溶解し、氷水浴上冷却攪拌下亜鉛末20.6gとビストリフェニルホスフィンパラジウムジクロリド5gを加えた。続いてo-トルオイルクロリド26.5gを滴下した。反応混合

物でふるい、乾燥ラウリル硫酸ナトリウム及び乾燥ステアリン酸マグネシウムを加えて混合し、打錠機で所望の形状に圧縮する。

【0436】上記の芯部をワニスで処理し、タルクを散布し、湿気の吸収を防止する。芯部の周囲に下塗り層を被覆する。内服用のために充分な回数のワニス被覆を行なう。錠剤を完全に丸く且つ平滑にするために更に下塗り層及び平滑被覆が適用される。所望の色合が得られるまで着色被覆を行なう。乾燥後、被覆錠剤を磨いて均一な光沢の錠剤にする。

#### 【0437】製剤例3

物は氷水浴上で3時間、室温で3日間攪拌した。不溶物を濾去し、残渣を酢酸エチル洗浄した。母液に飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和重曹水、0.5N塩酸、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液：酢酸エチル：n-ヘキサン=50：1～10：1）後、トルエン-n-ヘキサンで再結晶し、4-〔(2-メチルベンゾイル)メチル〕安息香酸メチルエステル15gを得た。

#### 【0439】参考例2

4-メトキシカルボニルベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド19.1g及びナトリウムメチラート2.77gをメタノール20mlに懸濁し、室温で1時間攪拌した。o-クロロベンズアルデヒド5gを加え、室温で1時間攪拌後ナトリウムメチラート5.54gを加え

更に室温で1時間攪拌した。反応混合物を濃縮後、残渣に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機相を、水、0.5 N塩酸、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣にジエチルエーテル-n-ヘキサンを加え不溶物を濾去した。母液を濃縮後残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液；n-ヘキサン：酢酸エチル=30：1）で精製した。初めにメチル 4-（2-クロロスチリル）ベンゾエート（シス体）が、続いてメチル 4-（2-クロロスチリル）ベンゾエート（トランス体）が溶出してきた。シス体は2.15 g、トランス体は1.42 g、いずれも白色粉末として得た。

#### 【0440】参考例3

メチル 4-（2-クロロスチリル）ベンゾエート（トランス体）1.42 g、5 N水酸化ナトリウム1.6 ml及びメタノール20 mlを室温で3時間、次いで2時間加熱還流した。メタノールを減圧で留去し、残渣に水を加え、次いで濃塩酸で酸性にした。室温で16時間攪拌後、析出物を濾取すると4-（2-クロロスチリル）安息香酸が白色粉末として1.36 g得られた。

#### 【0441】参考例4

4-プロモ安息香酸7.2 g及びチオニルクロリド20 mlを1時間加熱還流後濃縮し、次に残渣にトルエンを加えて再度濃縮した。この4-プロモ安息香酸クロリドを2-アミノ-2-メチル-1-プロパノール5.1 ml、トリエチルアミン10 ml及びジクロロメタン70 mlの混合物中に、氷冷下滴下した。反応混合物を室温で5時間攪拌後、氷を加えてジクロロメタン抽出した。有機相を0.5 N-塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣をジクロロメタン50 mlに溶解し、氷冷下、チオニルクロリド7.8 mlを滴下した。室温で3時間攪拌後氷冷にし、5 N-水酸化ナトリウム水を徐々に加えてアルカリ性にした。ジクロロメタン抽出し、有機層を水洗、硫酸マグネシウム乾燥すると、2-（4-プロモフェニル）-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリンが無色油状物として8.35 g得られた。b p 162-164℃/22 mmHg。

#### 【0442】参考例5

マグネシウム526 mg及び乾燥テトラヒドロフラン50 mlを加熱還流下2-（4-プロモフェニル）-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン1 gの乾燥テトラヒドロフラン（10 ml）溶液に滴下した。加熱を止め、ゆっくり還流する程度の速度で2-（4-プロモフェニル）-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン4 gを滴下した。その際30分攪拌後、氷冷にしてo-トルアルデヒド2.16 mlを滴下した。氷冷で1時間、室温で2時間攪拌後、飽和塩化アンモニウム水を加えて反応を中止し、酢酸エチル抽出した。有機層を1 N-塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸

マグネシウム乾燥後濃縮した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー精製（溶出液；n-ヘキサン：酢酸エチル=4~2：1）により2-〔4-〔1-（2-メチルフェニル）-1-ヒドロキシメチル〕フェニル〕-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリンを白色粉末状として3.07 g得た。

【0443】<sup>1</sup>H-NMR（200 MHz, CDCl<sub>3</sub>）  
δ ppm：1.35（6H, s）, 2.24（3H, s）, 3.04（1H, d, J=4 Hz）, 4.08（1H, s）, 5.99（1H, d, J=4 Hz）, 7.03-7.55（6H, m）, 7.76-7.94（2H, m）。

#### 【0444】参考例6

2-〔4-〔1-（2-メチルフェニル）-1-ヒドロキシメチル〕フェニル〕-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン3.0 g、二酸化マンガニ20 g及びジクロロメタン50 mlを室温で混合し、室温で2時間、その後3時間加熱還流した。不溶物をセライト濾過しクロロホルム洗浄した後、母液を濃縮すると淡黄色油状物として2-〔4-（2-メチルベンゾイル）フェニル〕-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリンを2.86 g得た。

【0445】<sup>1</sup>H-NMR（200 MHz, CDCl<sub>3</sub>）  
δ ppm：1.40（6H, s）, 2.33（3H, s）, 4.14（2H, s）, 7.12-7.54（4H, m）, 7.76-7.92（2H, m）, 7.95-8.14（2H, m）。

#### 【0446】参考例7

2-〔4-（2-メチルベンゾイル）フェニル〕-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン2.86 g及び4.5 M塩酸150 mlを8時間加熱還流した。室温まで冷却し、水を加えて析出物を濾取すると4-（2-メチルベンゾイル）安息香酸が白色粉末として2.23 g得られた。

【0447】<sup>1</sup>H-NMR（200 MHz, CDCl<sub>3</sub>）  
δ ppm：2.37（3H, s）, 7.19-7.58（4H, m）, 7.80-8.03（2H, m）, 8.10-8.35（2H, m）, 10.4（1H, br s）。

#### 【0448】参考例8

アルゴン気流下、3-メトキシ-4-トリフルオロメチルスルホンilオキシ安息香酸メチルエステル5 gのトルエン200 ml溶液へ、テトラキス（トリフェニルフォスフィン）パラジウム0.9 gを加え、室温にて5分攪拌した。そこへ、（2-メチルフェニル）ホウ酸3.2 g、リチウムクロリド1.01 g及び2M炭酸ナトリウム水溶液11.9 mlを加え、100℃にて2時間攪拌した。水を加え、パラジウムをセライト濾別し、濾液をジエチルエーテルにて抽出した。エーテル層を水洗乾燥後、減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液；n-ヘキサン→酢酸エチル；n-ヘキサン=

1 : 10) に付し、4.07 g の3-メトキシ-4-(2-メチルフェニル)安息香酸メチルエステルを油状物として得た。

【0449】 $^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.12 (3H, s), 3.82 (3H, s), 3.95 (3H, s), 7.02~7.48 (5H, m), 7.63 (1H, d,  $J=1.51\text{ Hz}$ ), 7.71 (1H, dd,  $J=1.5\text{ Hz}$ , 7.74 Hz)。

【0450】適当な出発原料を用い、参考例8と同様にして後記実施例22、23及び35~64の化合物を得た。

#### 【0451】参考例9

アルゴン雰囲気下、2-(4-フェニル-2-メトキシフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン3.00 g をテトラヒドフラン30 ml に溶解後、氷浴上にて冷却撹拌した。同温度にて約2モル/l-n-プロピルマグネシウムブロミド-テトラヒドフラン溶液8.0 ml を徐々に滴下した。滴下終了後、室温に戻し16時間撹拌した。反応液を再度氷浴上にて冷却撹拌下、飽和塩化アンモニウム水溶液30 ml を加え、室温に戻した後、有機層を分取した。更に、水層より酢酸エチルで抽出(30 ml  $\times$  2)した。有機層を合わせ、飽和食塩水洗浄(100 ml  $\times$  2)後、硫酸マグネシウム上で乾燥した。溶媒を減圧留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: n-ヘキサン=1:2 $\rightarrow$ 1:1)にて精製し、溶媒を減圧留去後、2-(4-フェニル-2-n-プロピルフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリンを無色透明粘稠油として、2.81 g 得た。

【0452】 $^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.98 (3H, t,  $J=11.3\text{ Hz}$ ), 1.39 (6H, s), 1.52-1.77 (2H, m), 2.99 (2H, dd,  $J=7.5\text{ Hz}$ ,  $J=9.5\text{ Hz}$ ), 4.08 (2H, s), 7.30-7.51 (5H, m), 7.52-7.63 (2H, m), 7.78 (1H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ )。

#### 【0453】参考例10

濃塩酸30 ml 及び水酢酸10 ml の混合液に2-(4-フェニル-2-n-プロピルフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン2.70 g を加え、3日間(9時間 $\times$ 3)加熱還流した。反応液を約2分の1に減圧濃縮後、氷浴上冷却した。析出晶を濾取し、この析出晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー精製(溶出液; ジクロロメタン $\rightarrow$ ジクロロメタン: メタノール=50:1)し、溶媒を減圧留去後、残渣結晶をn-ヘキサンにて再結晶し、4-フェニル-2-n-プロピル安息香酸を無色針状として、1.67 g 得た。

【0454】mp 107.5~108.5 $^{\circ}\text{C}$ 。

#### 【0455】参考例11

2-(4-プロモ-2-メチルフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン5 g の乾燥テトラヒドフラン40 ml 溶液に、-70 $^{\circ}\text{C}$ にて、1.6Mn-ブチルリチウム14.0 ml のn-ヘキサン溶液を滴下した。同温度で30分撹拌後、シクロヘキサノン2.1 ml を滴下し、そのまま1時間撹拌した。水を加え、テトラヒドフランを減圧留去した後、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=100:1 $\rightarrow$ 60:1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにて再結晶し、2-[4-(1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシル)-2-メチルフェニル]-4,4-ジメチル-2-オキサゾリンを4.29 g 得た。

#### 【0456】白色粉末状

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.14-1.98 (11H, m), 1.38 (6H, s), 2.57 (3H, s), 4.05 (2H, s), 7.19-7.45 (2H, m), 7.72 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ )。

#### 【0457】参考例12

2-[4-(1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシル)-2-メチルフェニル]-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン4.29 g の酢酸40 ml 溶液に10%塩酸20 ml を加え、2日間還流した。析出する結晶を濾取し、水洗、乾燥後、4-シクロヘキシル-2-メチル安息香酸を2.61 g 得た。

#### 【0458】白色粉末状

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.55-1.93 (4H, m), 2.13-2.31 及び2.32-2.56 (各2H, 各m), 2.66 (3H, s), 6.17-6.34 (1H, m), 7.15-7.42 (2H, m), 7.90-8.18 (1H, m)。

#### 【0459】参考例13

4-シクロヘキセニル-2-メチル安息香酸2.61 g のエタノール30 ml 及び酢酸エチル30 ml 溶液に5%パラジウム-炭素0.4 g を加え、水素雰囲気下、常温常圧下30分撹拌した。パラジウム-炭素をセライト濾別し、濾液の溶媒を減圧留去後、結晶を濾取し、アセトン-n-ヘキサンにて結晶化し、洗浄して、2.27 g の4-シクロヘキシル-2-メチル安息香酸を得た。

#### 【0460】白色粉末状

mp 129~130 $^{\circ}\text{C}$ 。

#### 【0461】参考例14

N-メチルピペリドン5 ml に4-フェニルピペリンジン0.5 g、p-フルオロベンゾニトリル0.37 g 及び炭酸カリウム0.78 g を溶解し、120 $^{\circ}\text{C}$ で5時間撹拌した。反応液に酢酸エチル50 ml を加え、精製水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥後濾過し、

減圧下濃縮した。得られた残渣にメタノールを加え、不溶結晶を濾取し、減圧下で乾燥して4-フェニル-1-(4-シアノフェニル)ピペリジン0.39gを、白色針状として得た。

【0462】mp 167~169℃。

【0463】参考例15

4-フェニル-1-(4-シアノフェニル)ピペリジン0.39gに酢酸10ml及び濃塩酸10mlを加えて5時間還流した。反応液を濃縮し、残渣にジエチルエーテル-メタノールを加え不溶結晶を濾取し、減圧下で乾燥して4-フェニル-1-(4-カルボキシフェニル)ピペリジン0.39gを、白色粉末状として得た。

【0464】mp 257~259℃(分解)。

【0465】参考例16

ホモピペラジン100gをエタノール500mlに溶かし、沃化エチル19.8mlを徐々に滴下した。室温で一晩攪拌した後、不溶物を濾過して除去した。溶媒を減圧下に除去した後、蒸留により精製し、1-エチルホモピペラジン50gを得た。

【0466】無色油状

bp 86~88℃/37mmHg

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.06 (3H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 1.68-1.93 (2H, m), 2.54 (2H, q,  $J=7.$

2Hz), 2.63-2.76 (7H, m), 2.87-3.01 (2H, m)。

【0467】参考例17

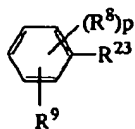
4-フェニル-2-クロロ-1-トリフルオロメチルスルホニルオキシベンゼン35gのジメチルホルムアミド300ml溶液に、一酸化炭素雰囲気下、酢酸パラジウム1.17g、1.3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン4.29g、エタノール91.5ml及びトリエチルアミン29.0mlを加え、80~90℃で6時間加熱攪拌した。反応液に水を加えてn-ヘキサンを少量加えて酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水洗乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; n-ヘキサン→酢酸エチル: n-ヘキサン=1:100)に付し、4-フェニル-2-クロロ安息香酸エチルを20.9g、無色油状物として得た。

【0468】 $^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.42 (3H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 4.42 (2H, q,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 7.28-7.78及び7.85-8.18 (全8H, m)。

【0469】適当な出発原料を用い、前記参考例17と同様にて下記の化合物を得た。

【0470】

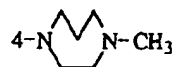
【表1】



参考例 18

構造

$R^9$  :



$p$  : 1

$R^8$  : 2-Cl

$R^{23}$  :  $-\text{COOCH}_3$

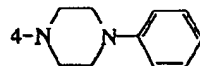
結晶形 : 褐色油状

形態 : 遊離

参考例 19

構造

$R^9$  :



$p$  : 1

$R^8$  : 2-Cl

$R^{23}$  :  $-\text{COOCH}_3$

結晶形 : 褐色油状

形態 : 遊離

【0471】

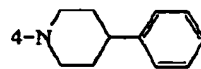
【表2】



参考例 20

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

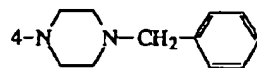
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 21

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

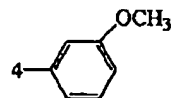
結晶形 : 黄色油状

形態 : 遊離

参考例 22

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

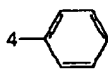
【0472】

【表3】

参考例 23

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-NO<sub>2</sub>

R<sup>23</sup> :

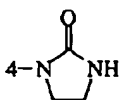
-COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 黄色粘稠油  
形態 : 遊離

参考例 24

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

R<sup>23</sup> :

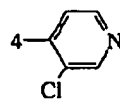
-COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 25

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> :

-COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡黄色固体  
形態 : 遊離

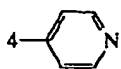
【0473】

【表4】

参考例 26

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

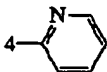
R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡黄色油状  
形態 : 遊離

参考例 27

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : H

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡黄色粉末状  
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル  
融点 : 96-98℃  
形態 : 遊離

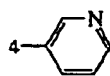
【0474】

【表5】

参考例 28

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : H

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

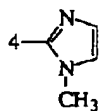
融点 : 100 - 102℃

形態 : 遊離

参考例 29

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : H

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡褐色粉末状

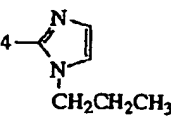
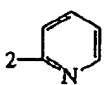
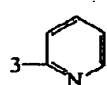
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 126 - 128℃

形態 : 遊離

【0475】

【表6】

参考例 30	
構造	
R <sup>9</sup> :	
P :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
結晶形	褐色油状
形態	遊離
参考例 31	
構造	
R <sup>9</sup> :	
P :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
結晶形	淡褐色油状
形態	遊離
参考例 32	
構造	
R <sup>9</sup> :	
P :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
結晶形	淡黄色油状
形態	遊離

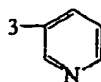
【0476】

【表7】

参考例 33

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : H

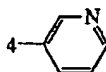
R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形態 : 淡黄色油状  
遊離

参考例 34

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

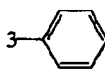
R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形態 : 褐色油状  
遊離

参考例 35

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

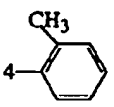
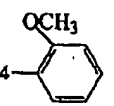
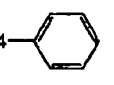
R<sup>8</sup> : H

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形態 : 無色油状  
遊離

【0477】

【表8】

参考例 36		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : 2-OCH <sub>3</sub>
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>	
結晶形	:	微黄色油状
形態	:	遊離
参考例 37		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : 2-OCH <sub>3</sub>
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>	
結晶形	:	無色油状
形態	:	遊離
参考例 38		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : 2-OCH <sub>3</sub>
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>	
結晶形	:	無色油状
形態	:	遊離

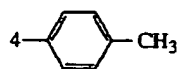
【0478】

【表9】

参考例 39

構造

R<sup>9</sup> :



p : 2

R<sup>8</sup> : 3, 5-di-OCH<sub>3</sub>

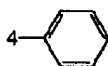
R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色プリズム状  
形態 : 遊離

参考例 40

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

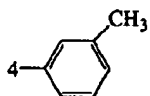
R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

参考例 41

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : H

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

【0479】

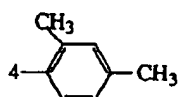
【表10】



参考例 42

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> :

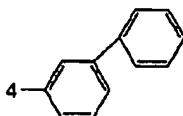
-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

参考例 43

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : H

R<sup>23</sup> :

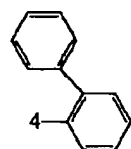
-CO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 44

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : H

R<sup>23</sup> :

-CO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

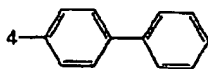
【0480】

【表11】

参考例 45

構造

R<sup>9</sup> :



P :

1

R<sup>8</sup> : H

R<sup>23</sup> :

-CO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

結晶形

:

白色粉末状

形態

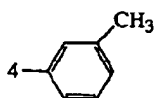
:

遊離

参考例 46

構造

R<sup>9</sup> :



P :

1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> :

-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形

:

微黄色油状

形態

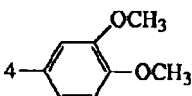
:

遊離

参考例 47

構造

R<sup>9</sup> :



P :

1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> :

-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形

:

白色粉末状

形態

:

遊離

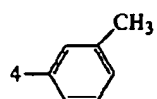
【0481】

【表12】

参考例 48

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

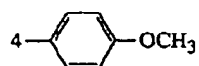
結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

参考例 49

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

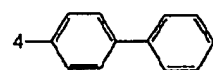
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 50

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

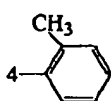
【0482】

【表13】

参考例 51

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

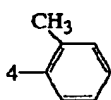
R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

参考例 52

構造

R<sup>9</sup> :



p : 2

R<sup>8</sup> : 3,5-di-OCH<sub>3</sub>

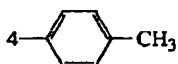
R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 53

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

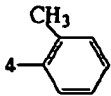
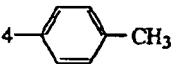
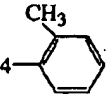
R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色プリズム状  
形態 : 遊離

【0483】

【表14】

参考例 54		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
R <sup>23</sup> :	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
結晶形	:	無色油状
形態	:	遊離
参考例 55		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : H
R <sup>23</sup> :	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
結晶形	:	白色粉末状
形態	:	遊離
参考例 56		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : H
R <sup>23</sup> :	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
結晶形	:	白色粉末状
形態	:	遊離

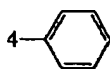
【0484】

【表15】

参考例 57

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

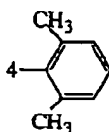
R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色プリズム状  
形態 : 遊離

参考例 58

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

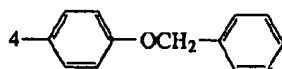
R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

参考例 59

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

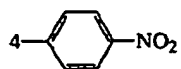
【0485】

【表16】

参考例 60

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

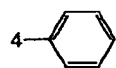
R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 微黄色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 61

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

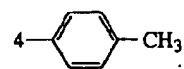
R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

参考例 62

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 微黄色粉末状  
形態 : 遊離

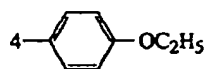
【0486】

【表17】

参考例 63

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

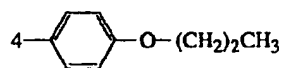
R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 64

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

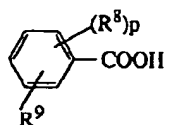
R<sup>23</sup> : -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

【0487】適当な出発原料を用い、前記参考例3、  
7、10又は12と同様にして下記の化合物を得た。

【0488】  
【表18】





参考例 65

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

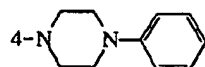
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 66

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

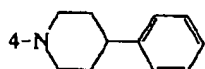
結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

参考例 67

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

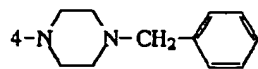
【0489】

【表19】

参考例 68

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

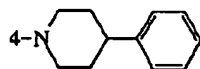
R<sup>8</sup> : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 69

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

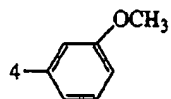
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
融点 : 257 - 259℃ (分解)  
形態 : 遊離

参考例 70

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

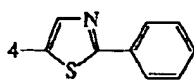
【0490】

【表20】

参考例 71

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

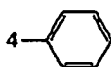
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 褐色粉末状  
形態 : 遊離  
融点 : 233 - 235℃

参考例 72

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

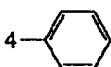
R<sup>8</sup> : 2-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

結晶形 : 無色板状  
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-クロロホルム  
融点 : 164 - 165℃  
形態 : 遊離

参考例 73

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-n-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>

結晶形 : 無色針状  
結晶溶媒 : n-ヘキサン  
融点 : 107.5 - 108.5℃  
形態 : 遊離

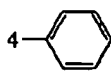
【0491】

【表21】

参考例 74

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

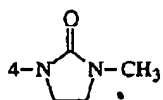
R<sup>8</sup> : 2-NO<sub>2</sub>

結晶形 : 赤褐色粉末状  
融点 : 199 - 201℃  
形態 : 遊離

参考例 75

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

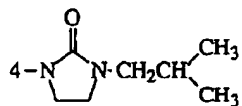
R<sup>8</sup> : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 76

構造

R<sup>9</sup> :



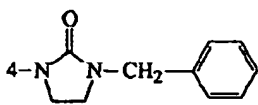
p : 1

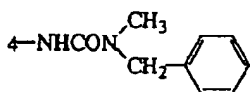
R<sup>8</sup> : 2-Cl

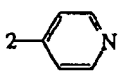
結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

【0492】

【表22】

参考例 77			
構造			
R <sup>9</sup>	:		
p	:	1	R <sup>8</sup> : 2-Cl
結晶形	:	微赤色粉末状	
形態	:	遊離	

参考例 78			
構造			
R <sup>9</sup>	:		
p	:	1	R <sup>8</sup> : H
結晶形	:	白色粉末状	
形態	:	遊離	

参考例 79			
構造			
R <sup>9</sup>	:		
p	:	1	R <sup>8</sup> : H
結晶形	:	白色粉末状	
形態	:	遊離	

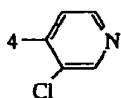
【0493】

【表23】

参考例 80

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

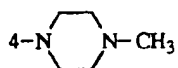
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : HCl

参考例 81

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

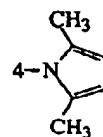
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 褐色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 82

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡褐色粉末状  
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル  
融点 : 133 - 135℃  
形態 : 遊離

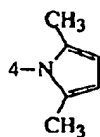
【0494】

【表24】

参考例 83

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

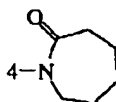
R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 褐色粉末状  
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル  
融点 : 126 - 128℃  
形態 : 遊離

参考例 84

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

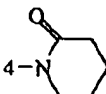
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル  
融点 : 198 - 201℃  
形態 : 遊離

参考例 85

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル  
融点 : 236 - 239℃  
形態 : 遊離

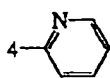
【0495】

【表25】

参考例 86

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

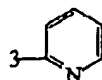
融点 : 257 - 260℃

形態 : 遊離

参考例 87

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

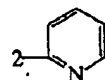
融点 : 201 - 203℃

形態 : 遊離

参考例 88

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 230℃ (分解)

形態 : HCl

【0496】

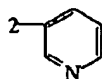
【表26】



参考例 89

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

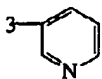
融点 : 206 - 207℃

形態 : HCl

参考例 90

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

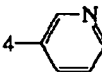
融点 : 266 - 269℃

形態 : HCl

参考例 91

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール

融点 : 276 - 279℃

形態 : HCl

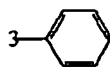
【0497】

【表27】

参考例 92

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

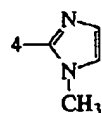
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 161 - 163℃  
形態 : 遊離

参考例 93

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

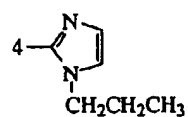
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 淡黄色粉末状  
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 250 - 251℃  
形態 : 遊離

参考例 94

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 黄色不定形  
形態 : 遊離

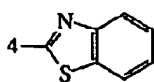
【0498】

【表28】

参考例 95

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

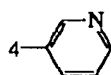
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色針状  
形態 : 遊離

参考例 96

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

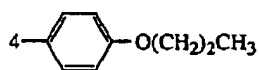
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 淡黄色針状  
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 309 - 311℃  
形態 : HCl

参考例 97

構造

R<sup>9</sup> :



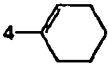
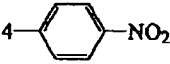
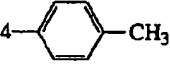
p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 198 - 200℃  
形態 : 遊離

【0499】

【表29】

参考例 98	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形	: 白色粉末状
形態	: 遊離
参考例 99	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形	: 白色粉末状
形態	: 遊離
参考例 100	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形	: 白色粉末状
再結晶溶媒	: アセトン-n-ヘキサン
融点	: 208℃
形態	: 遊離

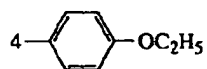
【0500】

【表30】

参考例 101

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

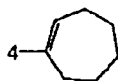
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 234 - 236℃  
形態 : 遊離

参考例 102

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

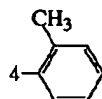
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 103

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 132 - 133℃  
形態 : 遊離

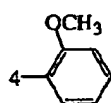
【0501】

【表31】

参考例 104

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

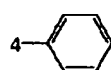
融点 : 153 - 154℃

形態 : 遊離

参考例 105

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

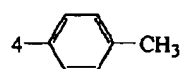
融点 : 118 - 119℃

形態 : 遊離

参考例 106

構造

R<sup>9</sup> :



p : 2

R<sup>8</sup> : 3, 5-di-OCH<sub>3</sub>

再結晶溶媒 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 239 - 240℃

形態 : 遊離

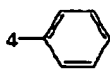
【0502】

【表32】

参考例 107

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

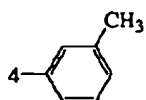
R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン  
融点 : 179 - 182℃  
形態 : 遊離

参考例 108

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

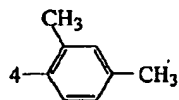
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン  
融点 : 194 - 197℃  
形態 : 遊離

参考例 109

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン  
融点 : 149 - 150℃  
形態 : 遊離

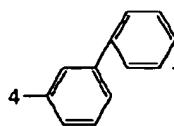
【0503】

【表33】

参考例 110

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

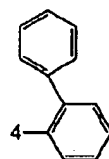
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 202 - 204℃  
形態 : 遊離

参考例 111

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

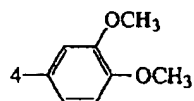
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 112

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 134 - 135℃  
形態 : 遊離

【0504】

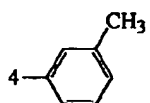
【表34】



参考例 113

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

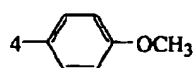
R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 114

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

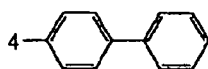
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 115

構造

R<sup>9</sup> :



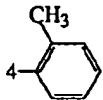
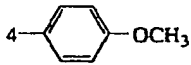
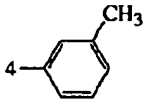
p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 262 - 265℃  
形態 : 遊離

【0505】

【表35】

参考例 116	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 3-OCH <sub>3</sub>
結晶形	: 白色粉末状
形態	: 遊離
参考例 117	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 3-OCH <sub>3</sub>
結晶形	: 白色粉末状
再結晶溶媒	: アセトン- <i>n</i> -ヘキサン
融点	: 146 - 147℃
形態	: 遊離
参考例 118	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
再結晶溶媒	: 白色粉末状
再結晶溶媒	: アセトン- <i>n</i> -ヘキサン
融点	: 132 - 133℃
形態	: 遊離

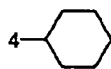
【0506】

【表36】

参考例 119

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

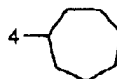
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン  
融点 : 129 - 130℃  
形態 : 遊離

参考例 120

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

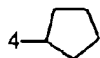
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 121

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡黄色粉末状  
形態 : 遊離

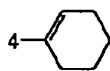
【0507】

【表37】

参考例 122

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

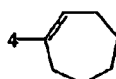
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 123

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

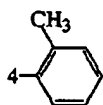
R<sup>8</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 124

構造

R<sup>9</sup> :



p :

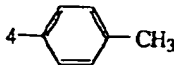
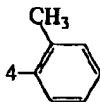
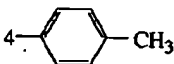
2

R<sup>8</sup> : 3,5-di-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン  
融点 : 231 - 232℃  
形態 : 遊離

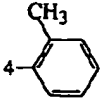
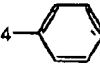
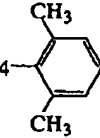
【0508】

【表38】

参考例 125	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 2-OCH <sub>3</sub>
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	アセトン-n-ヘキサン
融点 :	159 - 160℃
形態 :	遊離
参考例 126	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	アセトン-n-ヘキサン
融点 :	117 - 118℃
形態 :	遊離
参考例 127	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : H
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	エタノール-ジエチルエーテル
融点 :	246 - 248℃
形態 :	遊離

【0509】

【表39】

参考例 128	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : H
結晶形 :	無色プリズム状
再結晶溶媒 :	アセトン-n-ヘキサン
融点 :	185 - 187℃
形態 :	遊離
参考例 129	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形 :	白色粉末状
形態 :	遊離
参考例 130	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
	R <sup>8</sup> : 2-OCH <sub>3</sub>
再結晶溶媒 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	アセトン-n-ヘキサン
融点 :	145 - 148℃
形態 :	遊離

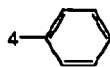
【0510】

【表40】

参考例 131

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン

融点 : 164℃

形態 : 遊離

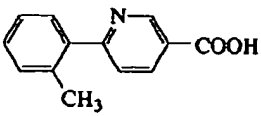
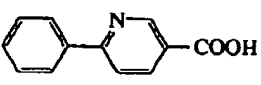
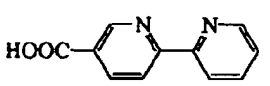
【0511】適当な出発原料を用い、前記参考例17と同様にして下記の化合物を得た。

【0512】  
【表41】

参考例	化合物 (形態)	物性
132	 (遊離)	白色針状 <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 200MHz) δppm: 3.97 (3H, s), 7.48-7.62 (3H, m), 7.81 (1H, dd, J=8.0Hz, J=0.8Hz), 7.98-8.17 (2H, m), 8.34 (1H, dd, J=8.0Hz, J=2.2Hz), 9.28 (1H, dd, J=2.2Hz, 0.8Hz).
133	 (遊離)	白色粉末状 <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 200MHz) δppm: 2.38 (3H, s), 3.98 (3H, s), 7.19-7.50 (4H, m), 7.50 (1H, dd, J=0.8Hz, J=8.0Hz), 8.35 (1H, dd, J=8.0Hz, J=2.0Hz), 9.30 (1H, dd, J=0.8Hz, 2.0Hz)
134	 (遊離)	淡褐色粉末状 融点: 110 - 111℃ 再結晶溶媒: クロロホルム-ジエチルエーテル

【0513】適当な出発原料を用い、前記参考例3、7、10又は12と同様にして下記の化合物を得た。

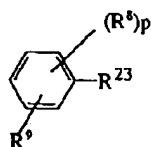
【0514】  
【表42】

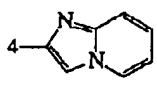
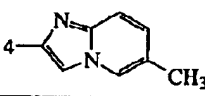


参考例	化合物 (形態)	物性
135	 (遊離)	無色針状 融点: 191 - 192℃
136	 (遊離)	無色針状 融点: 228 - 230℃
137	 (HCl)	淡褐色針状 融点: 253 - 255℃ 再結晶溶媒: メタノール・ジエチルエーテル

【0515】適当な出発原料を用い、前記参考例17と同様にして下記の化合物を得た。

【0516】

【表43】



参考例	R <sup>8</sup>	p	R <sup>9</sup>	R <sup>23</sup>
138	H	1		-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
139	H	1		-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
140	H	1		-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
141	2-CH <sub>3</sub>	1		-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

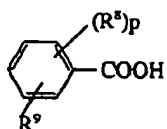
【0517】参考例138～参考例141で得られる化合物は、いずれも白色粉末状であった。

【0518】適当な出発原料を用い、前記参考例3、7、10又は12と同様にして下記の化合物を得た。

【0519】

【表44】





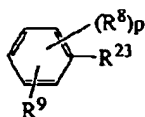
【0520】参考例142及び参考例143で得られる化合物は、いずれも白色粉末状であり、参考例144で得られる化合物は淡褐色粉末状であった。

【0521】適当な出発原料を用い、前記参考例17と同様にして下記の化合物を得た。

【0522】

【表45】

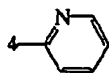
参考例	R <sup>8</sup>	p	R <sup>9</sup>
142	H	1	
143	H	1	
144	H	1	



参考例 145

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡黄色油状  
形態 : 遊離

参考例 146

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 黄色プリズム状  
形態 : 遊離

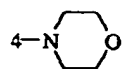
【0523】

【表46】

参考例 147

構造

R<sup>9</sup> :



P : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

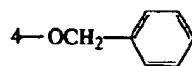
R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色針状  
形態 : 遊離

参考例 148

構造

R<sup>9</sup> :



P : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色粘稠油  
形態 : 遊離

参考例 149

構造

R<sup>9</sup> : 4-OH

P : 1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル  
融点 : 97 - 98.5℃  
形態 : 遊離

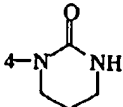
【0524】

【表47】

参考例 150	
構造	
R <sup>9</sup> :	$  \begin{array}{c}  \text{CH}_3 \\  \diagup \\  4-\text{OCH} \\  \diagdown \\  \text{CH}_3  \end{array}  $
p :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
結晶形	無色粘稠油
形態	遊離
参考例 151	
構造	
R <sup>9</sup> :	4-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>
p :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
結晶形	無色粘稠油
形態	遊離
参考例 152	
構造	
R <sup>9</sup> :	$  \begin{array}{c}  \text{CH}_3 \\  \diagup \\  4-\text{OCH}_2\text{CH} \\  \diagdown \\  \text{CH}_3  \end{array}  $
p :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
結晶形	無色粘稠油
形態	遊離

【0525】

【表48】

参考例 153	
構造	
R <sup>9</sup> :	4-NHCOCF <sub>3</sub>
p :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
R <sup>8</sup> :	2-Cl
結晶形態 :	白色粉末状遊離
参考例 154	
構造	
R <sup>9</sup> :	4-OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H
p :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
R <sup>8</sup> :	2-CH <sub>3</sub>
結晶形態 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	ジクロロメタン-n-ヘキサン
形態 :	遊離
参考例 155	
構造	
R <sup>9</sup> :	
p :	1
R <sup>23</sup> :	-COOCH <sub>3</sub>
R <sup>8</sup> :	2-Cl
再結晶溶媒 :	黄色粉末状
再結晶溶媒 :	酢酸エチル-n-ヘキサン
融点 :	118-123℃
形態 :	遊離

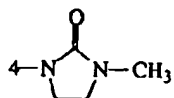
【0526】

【表49】

参考例 156

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

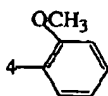
R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 157

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

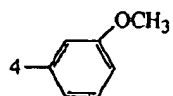
R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 158

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

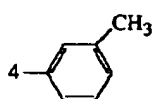
【0527】

【表50】

参考例 159

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

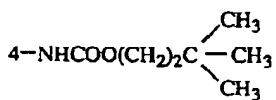
R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

参考例 160

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

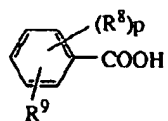
R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

R<sup>23</sup> : -COOCH<sub>3</sub>

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

【0528】

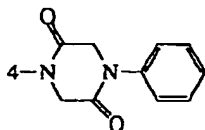
【表51】



参考例 161

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 淡褐色粉末状

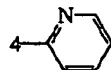
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

参考例 162

構造

R<sup>9</sup> :



p :

1

R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

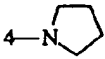
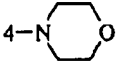
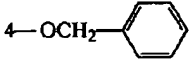
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

形態 : HCl

【0529】

【表52】

参考例 163		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : 2-Cl
結晶形	: 白色粉末状	
形態	: HCl	
参考例 164		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : 2-Cl
結晶形	: 白色粉末状	
形態	: 遊離	
参考例 165		
構造		
R <sup>9</sup> :		
p :	1	R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形	: 白色粉末状	
再結晶溶媒	: 酢酸エチル-n-ヘキサン	
融点	: 127.5 - 130℃	
形態	: 遊離	

【0530】

【表53】



参考例 166		
構造	R <sup>9</sup> :	
	$4-O-\underset{\text{CH}_3}{\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}}$	
p	:	1
		R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形	:	白色粉末状
形態	:	遊離
参考例 167		
構造	R <sup>9</sup> :	
	4-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	
p	:	1
		R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形	:	白色粉末状
形態	:	遊離
参考例 168		
構造	R <sup>9</sup> :	
	$4-OCH_2\underset{\text{CH}_3}{\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}}$	
p	:	1
		R <sup>8</sup> : 2-CH <sub>3</sub>
結晶形	:	淡黄色粉末状
形態	:	遊離

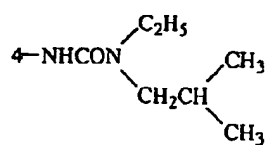
【0531】

【表54】

参考例 169

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

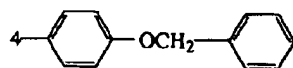
R<sup>8</sup> : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 170

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

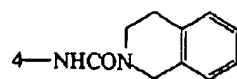
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 171

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-Cl

再結晶溶媒 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

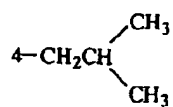
【0532】

【表5.5】

参考例 172

構造

R<sup>9</sup> :



P : 1

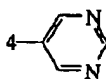
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 173

構造

R<sup>9</sup> :



P : 1

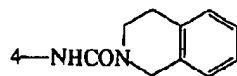
R<sup>8</sup> : 2-CH<sub>3</sub>

結晶形 : 黄色粉末状  
形態 : 遊離

参考例 174

構造

R<sup>9</sup> :



P : 1

R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

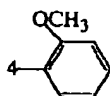
【0533】

【表56】

参考例 175

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

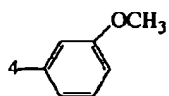
R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
融点 : 170 - 171℃  
形態 : 遊離

参考例 176

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

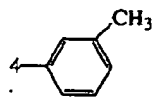
R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
融点 : 128 - 129℃  
形態 : 遊離

参考例 177

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 3-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
融点 : 146 - 147℃  
形態 : 遊離

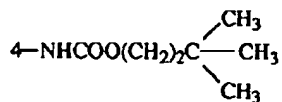
【0534】

【表57】

参考例 178

構造

R<sup>9</sup> :



p : 1

R<sup>8</sup> : 2-OCH<sub>3</sub>

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

【0535】上記で得られる各参考例化合物のNMRスペクトルは、次の通りである。

【0536】参考例18の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 90-3. 06 [全9H, m, 2. 38 (s)],  
3. 30-3. 72 (4H, m), 3. 85 (3H, s),  
6. 35-6. 81 [全2H, m, 6. 53 (d,  $J=8. 93\text{Hz}$ ,  $J=8. 99\text{Hz}$ ), 6. 67 (d,  $J=2. 32\text{Hz}$ )], 7. 83 (1H, d,  $J=8. 95\text{Hz}$ )。

【0537】参考例19の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
2. 92-3. 60 (全8H, m), 3. 88 (3H, s),  
6. 79-7. 48及び7. 78-7. 79 [全8H, m, 6. 79 (dd,  $J=8. 92\text{Hz}$ ,  $J=8. 92\text{Hz}$ )]。

【0538】参考例20の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 68-2. 09 [全4H, m, 1. 77 (d,  $J=3. 30\text{Hz}$ ), 1. 84 (d,  $J=4. 20\text{Hz}$ )],  
2. 61-3. 12 (全3H, m), 3. 75-4. 10 [全5H, m, 3. 87 (s)], 6. 78 (1H, dd,  $J=8. 96\text{Hz}$ ,  $J=8. 97\text{Hz}$ ),  
6. 92 (1H, d,  $J=2. 58\text{Hz}$ ), 7. 15-7. 41 (全5H, m), 7. 86 (1H, d,  $J=8. 92\text{Hz}$ )。

【0539】参考例21の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
2. 57 (3H, t,  $J=5. 21\text{Hz}$ ), 3. 31 (3H, t,  $J=5. 23\text{Hz}$ ), 3. 55 (2H, s),  
3. 86 (3H, s), 6. 72 (1H, dd,  $J=8. 95\text{Hz}$ ,  $J=8. 94\text{Hz}$ ), 6. 85 (1H, d,  $J=2. 56\text{Hz}$ ), 7. 19-7. 49 (5H, m),  
7. 82 (1H, d,  $J=8. 91\text{Hz}$ )。

【0540】参考例22の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
2. 66 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 3. 89 (3H, s),  
6. 81-7. 60 (6H, m), 7. 85-8. 08 (1H, m)。

【0541】参考例23の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
3. 94 (3H, s), 7. 39-7. 70 (5H, m),  
7. 79-7. 92 (2H, m), 8. 02-8. 11 (1H, m)。

【0542】参考例24の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:  
3. 4-3. 55 (2H, m), 3. 8 (3H, s),  
3. 8-3. 95 (2H, m), 7. 36 (1H, s),  
7. 50 (1H, dd,  $J=8. 8\text{Hz}$ ,  $J=2\text{Hz}$ ),  
7. 82 (1H, d,  $J=8. 8\text{Hz}$ ),

7. 86 (1H, d,  $J=2\text{Hz}$ )。

【0543】参考例25の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
2. 67 (3H, s), 3. 93 (3H, s), 7. 22-7. 43 (3H, m),  
7. 95-8. 08 (1H, m), 8. 48-8. 63 (1H, m), 8. 65-8. 75 (1H, m)。

【0544】参考例26の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
2. 69 (3H, s), 3. 93 (3H, s), 7. 41-7. 63 (4H, m),  
7. 95-8. 08 (1H, m), 8. 62-8. 76 (2H, m)。

【0545】参考例30の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
0. 88 (3H, t,  $J=7. 4\text{Hz}$ ), 1. 05 (3H, t,  $J=7. 4\text{Hz}$ ),  
1. 80 (3H, hept,  $J=7. 4\text{Hz}$ ), 4. 00 (2H, t,  $J=7. 4\text{Hz}$ ),  
4. 31 (3H, t,  $J=7. 4\text{Hz}$ ), 7. 06 (1H, d,  $J=1. 1\text{Hz}$ ),  
7. 17 (1H, d,  $J=1. 1\text{Hz}$ ), 7. 60-7. 76 (2H, m),  
8. 06-8. 22 (2H, m)。

【0546】参考例31の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
3. 68 (3H, s), 7. 20-7. 36 (1H, m),  
7. 40-7. 66 (4H, m), 7. 66-7. 90 (2H, m),  
8. 58-8. 74 (1H, m)。

【0547】参考例32の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
3. 96 (3H, s), 7. 22-7. 35 (1H, m),  
7. 56 (1H, t,  $J=7. 8\text{Hz}$ ), 7. 72-7. 86 (2H, m),  
8. 09 (1H, dt,  $J=1. 5\text{Hz}$ ,  $J=7. 8\text{Hz}$ ), 8. 24 (1H, dd,  $J=1. 2\text{Hz}$ ,  $J=1. 8\text{Hz}$ ,  $J=7. 8\text{Hz}$ ),  
8. 65 (1H, t,  $J=1. 6\text{Hz}$ ), 8. 69-8. 77 (1H, m)。

【0548】参考例33の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (250MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
3. 96 (3H, s), 7. 39 (1H, ddd,  $J=0. 8\text{Hz}$ ,  $J=4. 8\text{Hz}$ ,  $J=7. 8\text{Hz}$ ),  
7. 57 (1H, t,  $J=7. 8\text{Hz}$ ), 7. 75-7. 83 (1H, m),  
7. 87-7. 97 (1H, m), 8. 08 (1H, dt,  $J=1. 3\text{Hz}$ ,  $J=7. 8\text{Hz}$ ),  
8. 27 (1H, t,  $J=1. 6\text{Hz}$ ), 8. 63 (1H, dd,  $J=1. 6\text{Hz}$ ,  $J=4. 8\text{Hz}$ ),  
8. 88 (1H, dd,  $J=0. 7\text{Hz}$ ,  $J=2. 4\text{Hz}$ )。

【0549】参考例34の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (250MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
2. 69 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 7. 3

2-7.53 (3H, m), 7.89 (1H, ddd,  $J=1.7\text{ Hz}$ ,  $J=2.3\text{ Hz}$ ,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 8.03 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 8.63 (1H, dd,  $J=1.6\text{ Hz}$ ,  $J=4.8\text{ Hz}$ ), 8.86 (1H, dd,  $J=0.7\text{ Hz}$ ,  $J=1.6\text{ Hz}$ ).

【0550】参考例35の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (250MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.95 (3H, s), 7.32-7.56 (4H, m), 7.59-7.66 (2H, m), 7.75-7.83 (1H, m), 7.99-8.07 (1H, m), 8.25-8.33 (1H, m).

【0551】参考例36の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.27 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.92 (3H, s), 6.86-7.04 (2H, m), 7.16-7.41 (4H, m), 7.76-7.96 (1H, m).

【0552】参考例37の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.81, 3.90及び3.93 (各3H, 各s), 6.87-7.23 (4H, m), 7.29-7.52 (2H, m), 7.76-7.92 (1H, m).

【0553】参考例38の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.91及び3.97 (各3H, 各s), 7.11-7.28 (2H, m), 7.32-7.55 (3H, m), 7.56-7.70 (2H, m), 7.89 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ).

【0554】参考例39の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.39 (3H, s), 3.79 (6H, s), 3.95 (3H, s), 7.23 (4H, s), 7.33 (2H, s).

【0555】参考例40の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.87及び3.94 (各3H, 各s), 7.21-7.50 (4H, m), 7.51-7.61 (2H, m), 7.62-7.83 (2H, m).

【0556】参考例41の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.43及び3.94 (各3H, 各s), 7.08-7.29 (1H, m), 7.30-7.50 (3H, m), 7.58-7.72 (2H, m), 8.02-8.18 (2H, m).

【0557】参考例42の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.24, 2.37, 3.90及び3.91 (各3H, 各s), 6.78-6.98 (2H, m), 7.00-7.19 (3H, m), 7.73-7.90 (1H, m).

【0558】参考例43の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (250MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.42 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 4.41 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.27-7.90及び8.02-8.22 (全13H, m).

【0559】参考例44の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.37 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 4.34 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.01-7.31及び7.32-7.68 (全11H, m), 7.79-8.00 (2H, m).

【0560】参考例45の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.47 (3H, t,  $J=7\text{ Hz}$ ), 4.41 (2H, q,  $J=7\text{ Hz}$ ), 7.29-7.57, 7.58-7.84及び8.03-8.21 (全13H, m).

【0561】参考例46の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.42 (3H, s), 2.67 (3H, s), 3.91 (3H, s), 7.07-7.59 (6H, m), 7.87-8.11 (1H, m).

【0562】参考例47の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.91, 3.94, 3.97及び3.98 (各3H, 各s), 6.96 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.03-7.24 (4H, m), 7.88 (1H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ ).

【0563】参考例48の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.43, 3.91及び3.98 (各3H, 各s), 7.04-7.29 (3H, m), 7.30-7.51 (3H, m), 7.88 (1H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ ).

【0564】参考例49の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.67 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.90 (3H, s), 6.90-7.08 (2H, m), 7.35-7.49 (2H, m) 及び7.50-7.66 (2H, m), 7.89-8.07 (1H, m).

【0565】参考例50の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.69 (3H, s), 3.92 (3H, s), 7.27-7.81及び7.95-8.11 (全12H, m).

【0566】参考例51の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.12 (3H, s), 3.82 (3H, s), 3.95 (3H, s), 7.02-7.48 (5H, m), 7.63 (1H, d,  $J=1.4\text{ Hz}$ ), 7.71 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=1.4\text{ Hz}$ ).

【0567】参考例52の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.05 (3H, s), 3.77 (6H, s), 3.96 (3H, s), 7.03-7.18 (1H, m), 7.19-7.32 (3H, m), 7.34 (2H, s)。

【0568】参考例53の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.40, 3.90及び3.97 (各3H, 各s), 7.09-7.34 (4H, m), 7.42-7.59 (2H, m), 7.87 (1H, d,  $J=7.9\text{Hz}$ )。

【0569】参考例54の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.26, 2.65及び3.91 (各3H, 各s), 7.08-7.38 (6H, m), 7.89-8.02 (1H, m)。

【0570】参考例55の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.41及び3.93 (各3H, 各s), 7.17-7.34 (2H, m), 7.46-7.57 (2H, m), 7.58-7.72 (2H, m), 8.02-8.16 (2H, m)。

【0571】参考例56の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.26及び3.94 (各3H, 各s), 7.14-7.35 (4H, m), 7.36-7.52 (2H, m), 7.99-8.18 (2H, m)。

【0572】参考例57の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.68 (3H, s), 3.91 (3H, s), 7.29-7.54及び7.55-7.72 (全7H, m), 7.91-8.08 (1H, m)。

【0573】参考例58の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.04 (6H, s), 3.88及び3.92 (各3H, 各s), 6.71-6.85 (2H, m), 7.06-7.48 (3H, m), 7.78-7.93 (1H, m)。

【0574】参考例59の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.66 (3H, s), 3.90 (3H, s), 5.12 (2H, s), 6.98-7.12 (2H, m), 7.20-7.68 (10H, m)。

【0575】参考例60の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.70 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.38-7.58 (2H, m), 7.68-7.87 (2H, m), 7.98-8.12 (1H, m), 8.21-8.46 (2H, m)。

【0576】参考例61の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.42 (3H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 4.42 (2H, q,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 7.28-7.78及び7.85-8.18 (全8H, m)。

【0577】参考例62の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.40 (3H, s), 2.67 (3H, s), 3.90 (3H, s), 7.18-7.31 (2H, m), 7.37-7.58 (4H, m), 7.91-8.05 (1H, m)。

【0578】参考例63の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.44 (3H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 2.66 (3H, s), 3.90 (3H, s), 4.10 (2H, q,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 6.88-7.06 (2H, m), 7.34-7.49 (2H, m), 7.50-7.64 (2H, m), 7.89-8.06 (1H, m)。

【0579】参考例64の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.06 (3H, t,  $J=7.4\text{Hz}$ ), 1.70-1.97 (2H, m), 2.66 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.97 (2H, d,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 6.89-7.08 (2H, m), 7.35-7.48 (2H, m), 7.49-7.64 (2H, m), 7.89-8.08 (1H, m)。

【0580】参考例65の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 1.40-2.90及び3.21-3.90 [全13H, m, 2.33 (s)], 6.50-8.40 [全4H, m, 7.71 (d,  $J=8.41\text{Hz}$ )]。

【0581】参考例66の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.85-4.90 (全9H, m), 6.79-7.38及び7.45-7.69 (全7H, m)。

【0582】参考例68の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.60-4.75 (全11H, m), 6.80-7.85 [全8H, m, 7.77 (d,  $J=8.80\text{Hz}$ )]。

【0583】参考例70の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.74 (3H, s), 3.88 (3H, s), 5.82-8.39 [全8H, m, 6.95 (d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 8.15 (d,  $J=8.52\text{Hz}$ )]。

【0584】参考例75の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.77 (3H, s), 3.42-3.50 (2H, m), 3.78-3.86 (2H, m), 7.49

(1H, dd, J=8.8Hz, J=2.2Hz), 7.83 (1H, d, J=8.8Hz), 7.84 (1H, d, J=2.2Hz), 12.6-13.3 (1H, m)。

【0585】参考例76の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 0.86 (6H, d, J=6.6Hz), 1.8-2.05 (1H, m), 3.0 (2H, d, J=7.2Hz), 3.4-3.55 (2H, m), 3.8-3.95 (2H, m), 7.49 (1H, dd, J=8.8Hz, J=2.2Hz), 7.83 (1H, d, J=8.8Hz), 7.85 (1H, d, J=2.2Hz), 12.8-13.1 (1H, m)。

【0586】参考例77

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 3.3-3.41 (2H, m), 3.75-3.95 (2H, m), 4.39 (2H, s), 7.2-7.45 (5H, m), 7.5 (1H, dd, J=9Hz, J=2.2Hz), 7.84 (1H, d, J=9Hz), 7.88 (1H, d, J=2.2Hz)。

【0587】参考例78の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 2.93 (3H, s), 4.56 (2H, s), 7.20-7.50 (5H, m), 7.62 (2H, d, J=8.7Hz), 7.81 (2H, d, J=8.7Hz), 8.76 (1H, s)。

【0588】参考例79の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 7.38-7.51 (1H, m), 7.51-7.95 (4H, m), 7.95-8.10 (1H, m), 8.68-7.95 (2H, m), 10.3-13.5 (1H, br)。

【0589】参考例80の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 2.58 (3H, s), 7.38-7.48 (2H, m), 7.48-7.64 (1H, m), 7.46-8.01 (1H, m), 8.63 (1H, d, J=5.0Hz), 8.80 (1H, s)。

【0590】参考例81の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 2.22 (3H, s), 2.30-2.58 (4H, m), 3.15-3.40 (4H, m), 6.85-7.05 (2H, m), 7.15-7.84 (2H, m), 11.75-12.80 (1H, brs)。

【0591】参考例94の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 0.77 (3H, t, J=7.3Hz), 1.75 (2H, q, J=7.3Hz), 4.15 (2H, t, J=7.3Hz), 7.31-7.97 (3H, m), 8.02 (1H, d, J=1.7Hz), 8.11-

8.27 (2H, m)。

【0592】参考例95の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 7.19 (1H, s), 7.35-7.64 (2H, m), 7.69 (1H, s), 8.00-8.30 (4H, m), 10.40-11.62 (1H, brs)。

【0593】参考例98の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.55-1.94 (4H, m), 2.13-2.30 (2H, m), 2.31-2.56 (2H, m), 2.66 (3H, s), 6.18-6.35 (1H, m), 7.15-7.42 (2H, m), 7.90-8.18 (1H, m)。

【0594】参考例99の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 2.62 (3H, s), 7.58-7.82 (2H, m), 7.88-8.19 (3H, m), 8.21-8.48 (2H, m), 12.97 (1H, s)。

【0595】参考例102の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.42-2.00 (6H, m), 2.18-2.46 (2H, m), 2.47-2.79 (2H, m), 2.66 (3H, s), 6.21 (1H, t, J=6.7Hz), 7.05-7.40 (1H, m), 7.88-8.12 (1H, m)。

【0596】参考例111の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 7.03-7.31 (7H, m), 7.32-7.58 (4H, m), 7.95 (2H, d, J=8.35Hz)。

【0597】参考例113の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 2.30及び4.15 (各3H, 各s), 7.09-7.48 (6H, m), 8.23 (1H, d, J=8.1Hz), 10.00-11.42 (1H, m)。

【0598】参考例114の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 2.73及び3.87 (各3H, 各s), 7.00及び7.59 (各2H, 各dd, J=8.8Hz, J=2.1Hz), 7.36-7.52 (2H, m), 8.03-8.21 (1H, m)。

【0599】参考例116の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 2.14及び3.85 (各3H, 各s), 7.09-7.41 (5H, m), 7.71 (1H, d, J=1.4Hz), 7.82 (1H, dd, J=8.0Hz, J=1.5Hz)。

【0600】参考例120の化合物

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:



1. 21-2. 06及び2. 48-2. 82 (全13 H, m), 2. 63 (3H, s), 4. 84-6. 49 (1H, m), 6. 98-7. 19 (2H, m), 7. 99 (1H, d, J=8. 7Hz)。

【0601】参考例121の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1. 40-2. 23及び2. 87-3. 14 (全9H, m), 2. 64 (3H, s), 6. 98-7. 24 (2H, m), 8. 00 (1H, d, J=8. 7Hz)。

【0602】参考例122の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 1. 49-1. 88 (4H, m), 2. 08-2. 19及び2. 20-2. 52 (各2H, 各m), 6. 20-6. 40 (1H, m), 7. 51及び7. 87 (各2H, 各d, 各J=8. 4Hz), 12. 42-13. 18 (1H, m)。

【0603】参考例123の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 1. 49-1. 68 (4H, m), 1. 69-1. 91 (2H, m), 2. 18-2. 37 (2H, m), 2. 45-2. 67 (2H, m), 6. 23 (1H, t, J=6. 7Hz), 7. 42及び7. 86 (各2H, 各d, 各J=8. 4Hz), 7. 28-7. 79 (1H, m)。

【0604】参考例129の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2. 75 (3H, m), 7. 29-7. 74 (7H, m), 8. 10-8. 22 (1H, m)。

【0605】参考例138の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 1. 34 (3H, t, J=7. 2Hz), 4. 33 (2H, q, J=7. 2Hz), 6. 80-6. 95 (1H, m), 7. 20-7. 35 (1H, m), 7. 55-7. 65 (1H, m), 7. 98-8. 16 (4H, m), 8. 45-8. 60 (2H, m)。

【0606】参考例139の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 1. 34 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 29 (3H, s), 4. 33 (2H, q, J=7. 2Hz), 7. 10-7. 20 (1H, m), 7. 50-7. 58 (1H, m), 7. 95-8. 15 (4H, m), 8. 33 (1H, s), 8. 43 (1H, s)。

【0607】参考例140の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, s), 4. 37 (2H, q, J=7. 2Hz), 7. 60-7. 70 (2H, m), 8. 00-8. 11 (2H, m), 8. 42 (1H, brs)。

【0608】参考例141の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 61 (3H, s), 3. 88 (3H, s), 4. 20 (2H, s), 7. 40-7. 55 (2H, m), 7. 90-8. 01 (1H, m), 8. 30 (1H, brs)。

【0609】参考例142の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 7. 40-7. 55 (1H, m), 7. 85-8. 03 (2H, m), 8. 03-8. 25 (4H, m), 8. 85-9. 00 (2H, m), 12. 4-14. 1 (1H, brs)。

【0610】参考例143の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 2. 41 (3H, s), 7. 75-7. 95 (2H, m), 7. 95-8. 25 (4H, m), 8. 70 (1H, s), 8. 85 (1H, s), 12. 6-13. 6 (1H, brs)。

【0611】参考例144の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2. 07 (6H, s), 5. 94 (2H, s), 7. 30-7. 40 (2H, m), 8. 20-8. 30 (2H, m), 10. 7-12. 1 (1H, brs)。

【0612】参考例145の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2. 70 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 7. 22-7. 35 (1H, m), 7. 70-7. 96 (4H, m), 8. 03 (1H, d, J=8. 2Hz), 8. 67-8. 78 (1H, m)。

【0613】参考例146の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1. 92-2. 18及び3. 21-3. 45 (全8H, m), 3. 85 (3H, s), 6. 38 (1H, dd, J=2. 5Hz, J=2. 5Hz), 6. 52 (1H, d, J=2. 45Hz), 7. 88 (1H, d, J=11. 3Hz)。

【0614】参考例147の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3. 29 (4H, t, J=4. 8Hz), 3. 84 (4H, t, J=5. 1Hz), 3. 87 (3H, s), 6. 73 (1H, dd, J=2. 8Hz, 2. 6Hz), 6. 86 (1H, d, J=2. 7Hz), 7. 85 (1H, d, J=9. 0Hz)。

【0615】参考例148の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2. 60 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 5. 09 (2H, s), 6. 72-6. 99 (2H, m, 6. 83 (1H, s)), 7. 25-7. 48 (5H, m), 7. 93 (1H, d, J=9. 1Hz)。

【0616】参考例150の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1. 35 (6H, d, J=6. 1Hz), 2. 59 (3

H, s), 3.85 (3H, m), 4.49-4.71 (1H, m), 6.61-6.78 (2H, m), 7.82-7.98 (1H, m)。

【0617】参考例151の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.98 (3H, t,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 1.30-1.89 (4H, m), 2.59 (3H, s), 3.85 (3H, s), 4.13 (2H, t,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 6.68-6.80 (2H, m), 7.83-7.99 (1H, m)。

【0618】参考例152の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.03 (6H, d,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 1.98-2.21 (1H, m), 2.59 (3H, s), 3.75 (2H, d,  $J=6.6\text{Hz}$ ), 3.85 (3H, s), 6.66-6.81 (2H, m), 7.82-7.99 (1H, m)。

【0619】参考例153の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.94 (3H, s), 7.58 (1H, dd,  $J=8.6, 2.2\text{Hz}$ ), 7.78 (1H, d,  $J=2.2\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 8.32 (1H, brs)。

【0620】参考例154の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.50 (3H, s), 3.78 (3H, s), 4.75 (2H, s), 6.73-6.93 (2H, m), 7.82 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 13.09 (1H, brs)。

【0621】参考例156の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.88 (3H, s), 3.41-3.50 (2H, m), 3.79-3.89 (2H, m), 3.89 (3H, s), 3.90 (3H, s), 7.49 (1H, d,  $J=8.2\text{Hz}$ ), 7.87 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 7.65 (1H, dd,  $J=8.2\text{Hz}, 1.7\text{Hz}$ )。

【0622】参考例157の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.77, 3.83及び3.93 (各3H, 各s), 6.89-7.08 (2H, m), 7.15-7.44 (3H, m), 7.54-7.79 (2H, m)。

【0623】参考例158の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.84, 3.88及び3.94 (各3H, 各s), 6.83-6.98 (1H, m), 7.02-7.18 (2H, m), 7.27-7.43 (2H, m), 7.64 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.71 (1H, dd,  $J=1.6\text{Hz}, 7.8\text{Hz}$ )。

【0624】参考例160の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.79-1.02 [9H, m, 0.96 (s)], 1.59 (2H, t,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 3.86 (3H, s), 3.89 (3H, s), 4.23 (2H, t,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 6.90 (1H, dd,  $J=8.5\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$ ), 7.03 (1H, s), 7.43 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 7.80 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ )。

【0625】参考例161の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.55 (3H, s), 4.53 (2H, s), 4.55 (2H, s), 7.25-7.55 (7H, m), 7.88 (1H, d,  $J=9\text{Hz}$ ), 12.88 (1H, s)。

【0626】参考例162の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.62 (3H, s), 7.70-7.82 (1H, m), 7.90-8.13 (3H, m), 8.20-8.40 (2H, m), 8.72-8.86 (1H, m)。

【0627】参考例163の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 1.85-2.12 (4H, m), 3.12-3.46 (4H, m), 6.35-6.62 (2H, m), 7.74 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 12.35 (1H, brs)。

【0628】参考例164の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 3.25 (4H, t,  $J=5.0\text{Hz}$ ), 3.70 (4H, t,  $J=5.0\text{Hz}$ ), 6.80-7.09 (2H, m), 7.75 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ )。

【0629】参考例166の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 1.26 (6H, d,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 2.49 (3H, s), 4.56-4.80 (1H, m), 6.69-6.85 (2H, m), 7.75-7.85 (1H, m), 12.39 (1H, s)。

【0630】参考例167の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 0.93 (3H, t,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 1.33-1.55 (2H, m), 1.57-1.81 (2H, m), 2.51 (3H, s), 4.01 (2H, t,  $J=6.4\text{Hz}$ ), 6.72-6.90 [2H, m, 6.83 (1H, s)], 7.82 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 12.41 (1H, s)。

【0631】参考例168の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 0.96 (6H, d,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 1.87-2.15 (1H, m), 2.50 (3H, s), 3.

7.8 (2H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 6.72–6.88 (2H, m, 6.82 (1H, s)), 7.81 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 12.40 (1H, br s)。

【0632】参考例169の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.97 (6H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.23 (3H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.85–2.10 (1H, m), 3.13 (2H, d,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 3.39 (2H, q,  $J=7\text{ Hz}$ ), 6.54 (1H, s), 7.36 (1H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ , 2.2  $\text{Hz}$ ), 7.63 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.98 (1H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ )。

【0633】参考例170の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.57 (3H, s), 5.17 (2H, s), 6.58–6.92及び6.93–8.03 (全12H, m), 12.56–12.94 (1H, m)。

【0634】参考例171の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (250MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.84 (2H, t,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 3.70 (2H, t,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 4.64 (2H, s), 7.17 (4H, s), 7.54 (1H, dd,  $J=7\text{ Hz}$ , 1.6  $\text{Hz}$ ), 7.76–7.83 (2H, m), 9.01 (1H, s)。

【0635】参考例172の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 0.83 (6H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.68–1.97 (1H, m), 2.42 (2H, d,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.48 (3H, s), 6.93–7.13 (2H, m), 7.74 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )。

【0636】参考例173の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.61 (3H, s), 4.10–5.40 (2H, br s), 7.32–7.90 (4H, m), 7.95 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 9.22 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ )。

【0637】参考例174の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 2.86 (2H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.67 (2H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.89 (3H, s), 4.63 (2H, s), 7.18 (4H, s), 7.4–7.6 (2H, m), 7.84 (1H, s), 7.95 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )。

【0638】参考例178の化合物

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 0.93 (9H, s), 1.55 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 3.76 (3H, s), 4.15 (2H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.05 (1H, dd,  $J=8.6\text{ Hz}$ , 8.6  $\text{Hz}$ ), 7.64 (1H, d,  $J=8.9\text{ Hz}$ ), 7.34 (1H, d,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 9.88 (1H, s)。

8.6  $\text{Hz}$ , 8.6  $\text{Hz}$ ), 7.64 (1H, d,  $J=8.9\text{ Hz}$ ), 7.34 (1H, d,  $J=1.6\text{ Hz}$ ), 9.88 (1H, s)。

【0639】実施例1

4-エトキシ-2-メトキシ安息香酸0.33gを塩化チオニル10mlに溶かし、30分間加熱還流した。このものを減圧下に濃縮後、トルエン20mlを加えて再び減圧下濃縮した。得られた4-エトキシ-2-メトキシベンゾイルクロリドをジクロロメタン10mlに溶かした後、氷浴上で0℃に冷却し、7-クロロ-5-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノ]カルボニルメチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.5gを加えた。続いて、トリエチルアミン0.6mlを加え、そのままの温度で2時間攪拌した。反応物に水を加えてジクロロメタンにて抽出後、炭酸ナトリウムにて乾燥した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=50:1~5:1)にて精製した。得られた油状物をエタノールに溶かし、濃塩酸0.1mlを加え、減圧下に濃縮することにより7-クロロ-5-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノ]カルボニルメチル-1-(2-メトキシ-4-エトキシベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンの塩酸塩を無色不定形物として得た(0.2g)。

【0640】 $^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm: 0.98–2.06 (13H, m), 2.61–4.88 (21H, m), 6.18–7.45 (6H, m), 10.42–11.52 (1H, m)。

【0641】実施例2

4-シクロヘキシル安息香酸2gに塩化チオニル20mlを加え、2時間加熱還流した。塩化チオニルを留去し、4-シクロヘキシルベンゾイルクロリドを得た。5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2.2gのジクロロメタン50ml溶液にピリジン3.3gを加え、次いで氷冷攪拌下先の4-シクロヘキシルベンゾイルクロリドを加え、室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、ジクロロメタンにて抽出した。希塩酸で洗浄、水洗後、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン)にて精製して、5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン4gを得た。

【0642】無色油状

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.27 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.20–2.20 (14H, m), 2.30–2.50 (1H,

m), 2.60-3.05 (3H, m), 3.10-3.35 (1H, m), 4.10-4.40 (2H, m), 4.45-4.65 (1H, m), 6.57 (1H, d, J=8.4 Hz), 6.96 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.00 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.10-7.35 (3H, m)。

#### 【0643】実施例3

5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2 gのエタノール20 ml溶液に5N水酸化ナトリウム水溶液5 mlを加え、室温にて終夜攪拌した。反応液に塩酸を加えて酸性とした後、ジクロロメタンで抽出、水洗後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去して、5-カルボキシメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン1.8 gを得た。

#### 【0644】無色不定形

<sup>1</sup>H-NMR (200 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.20-2.25 (14H, m), 2.30-2.55 (1H, m), 2.60-3.30 (3H, m), 3.50-3.90 (1H, m), 4.45-4.60 及び5.10-5.30 (1H, m), 6.15 (1H, brs), 6.59 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.85-7.00 (3H, m), 7.10-7.35 (3H, m)。

【0645】適当な出発原料を用い、実施例3と同様にして下記実施例52、68、77、78、81~83、87、90、96、101、103、104、109、117~118、120及び131~135の化合物を得た。

#### 【0646】実施例4

5-カルボキシメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.7 gのジクロロメタン50 ml溶液に氷冷攪拌下、N, N-ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド0.54 gを加え、室温で15分間攪拌した。次いで氷冷攪拌下、N-メチルピペラジン0.24 ml及びトリエチルアミン0.46 mlを加え、室温で終夜攪拌した。水を加え、ジクロロメタンで抽出し、水洗後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下に溶媒を留去して、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=40:1)にて精製して、7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.7 gを得た。

#### 【0647】無色不定形

<sup>1</sup>H-NMR (200 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.20-3.40 (22H, m), 2.21及び2.34 (3H, s), 3.50-3.90 (5H, m), 4.40-4.60及び5.05-5.20 (1H, m), 6.50-6.60 (1H, m), 6.85-6.95 (1H, m), 7.00-7.15 (3H, m), 7.25-7.50 (2H, m)。

【0648】適当な出発原料を用い、実施例4と同様にして下記実施例7、9、11~18、20~22、24、25、28~36、38~40、46~48、55~67、70~72、74~76、79、84、85、88、91~94、98、121~126、137及び138の化合物を得た。

#### 【0649】実施例5

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)アセチル]ベンゾイル}-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2.06 gを塩化メチレン20 ml-メタノール20 mlの混合溶媒に溶解し、氷水浴上冷却攪拌下水素化ホウ素ナトリウム0.28 gを添加した。氷水浴上冷却下2時間攪拌後溶媒の大部分を減圧下留去した。残渣に水を加え塩化メチレン抽出した。有機層を飽和食塩水洗、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液: 塩化メチレン: メタノール=20:10:1)で精製し、無色不定形として7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシエチル]ベンゾイル}-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを2.08 g得た。

【0650】<sup>1</sup>H-NMR (200 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.1-4.0, 4.35-4.65, 4.65-5.0及び5.0-5.25 (全27H, m), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-7.6 (10H, m)。

【0651】適当な出発原料を用い、実施例5と同様にして下記実施例22、46及び94の化合物を得た。

#### 【0652】実施例6

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシエチル]ベンゾイル}-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.5 g、酢酸5 ml及び無水酢酸3 mlに濃硫酸1滴を加え室温で12時間、続いて60~70℃で6時間攪拌した。反応混合物を氷水に注ぎ、酢酸エチル30 mlを加え、このものに重曹を加えてアルカリ性にした。全体を酢酸エチルで抽出した後、有機相を飽和重曹水洗、飽和食塩水洗、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; 塩化メチレン: メタノール=20:1)で精製し、無色不定形として7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシエチル]ベンゾイル}-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを2.08 g得た。

ル) カルボニルメチル] -1- {4- [2- (2-メチルフェニル) -1-アセチルオキシエチル] ベンゾイル} -2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを0.36g得た。

【0653】<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>)  
 $\delta$  ppm: 1.1-4.0, 4.35-4.7及び4.95-5.25 (全28H, m), 5.7-6.0 (1H, m), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-

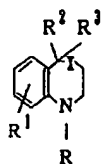
7.6 (10H, m)。

【0654】適当な出発原料を用いて、実施例6と同様にして下記実施例12及び48の化合物を得た。

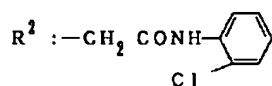
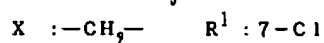
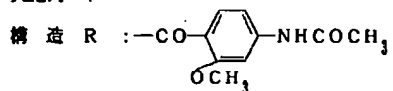
【0655】適当な出発原料を用い、実施例1及び2と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【0656】

【表58】



# 実施例 7



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

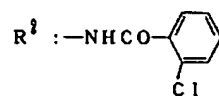
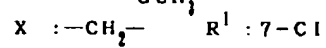
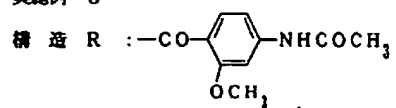
融点 : 146-148℃

形態 : 遊離

【表59】

【0657】

実施例 8



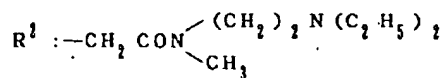
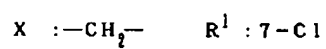
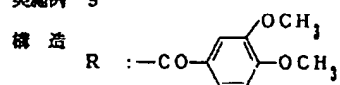
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 184-186℃

形 態 : 遊 離

実施例 9



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 1)

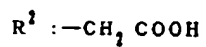
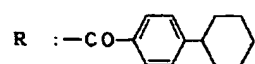
形 態 : 遊 離

【0658】

【表60】

実施例 10

構造



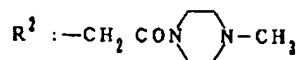
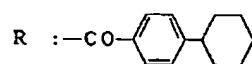
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 2)

形態 : 遊離

実施例 11

構造



結晶形 : 無色不定形

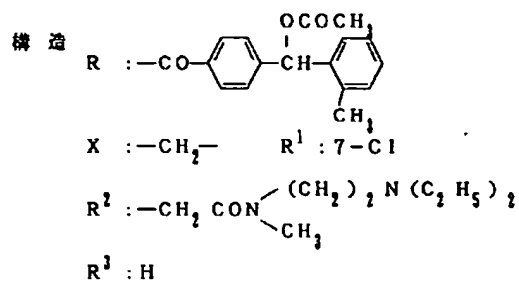
NMRスペクトル : 3)

形態 : 遊離

【0659】

【表6-1】

実施例 12

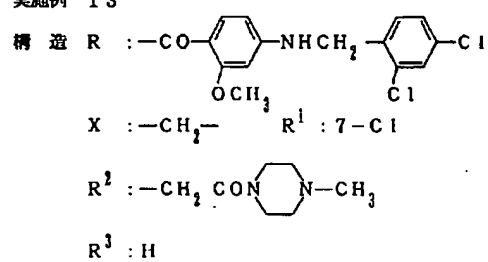


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 4)

形態 : 塩酸塩

実施例 13



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 186-187°C

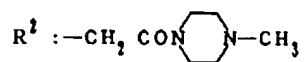
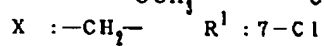
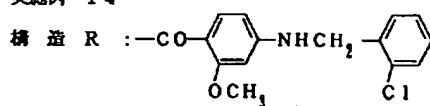
形態 : 遊離

【0660】

【表62】



実施例 14



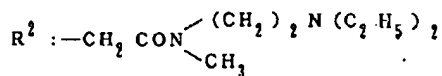
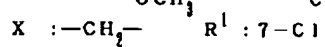
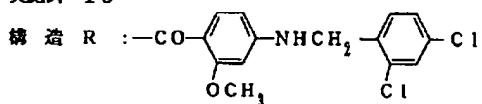
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融 点 : 162-162.5℃

形 態 : 遊離

実施例 15



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 5)

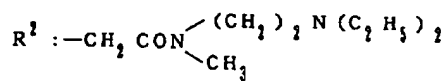
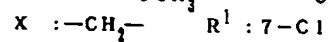
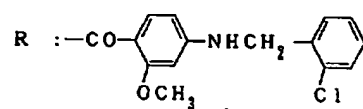
形 態 : 遊離

【0661】

【表63】

実施例 16

構造



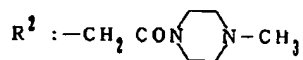
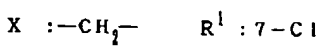
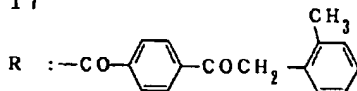
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 6)

形態 : 遊離

実施例 17

構造



結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : エタノール

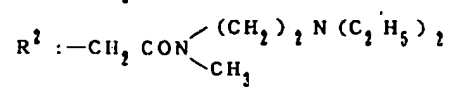
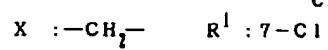
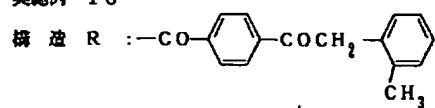
融点 : 181-182.5℃

形態 : 遊離

【0662】

【表6-4】

### 实施例 18



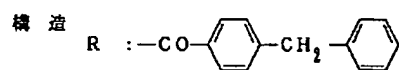
結 晶 形：無色針狀

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融 点 : 123-126℃

形態：遊 離

### 实施例 19



**結晶形**：無色板狀

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-*n*-ヘキサン

融 点 : 87.5-88℃

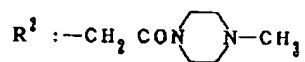
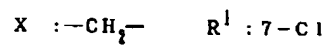
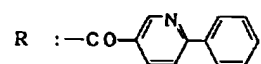
形 態：遊 離

【0663】

【表 6 5】

実施例 20

構造



結晶形 : 白色粉末状

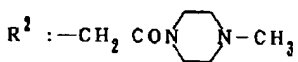
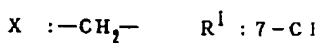
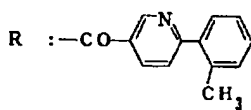
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 152-153℃

形態 : 遊離

実施例 21

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 7)

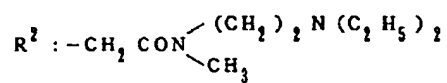
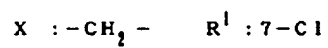
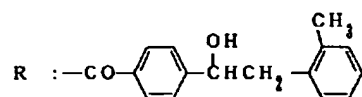
形態 : 遊離

【0664】

【表66】

実施例 22

構造



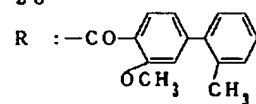
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 8)

形態 : 遊離

実施例 23

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 9)

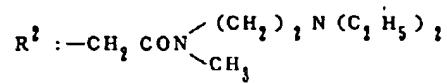
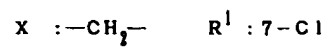
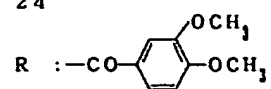
形態 : 遊離

【0665】

【表67】

実施例 24

構造



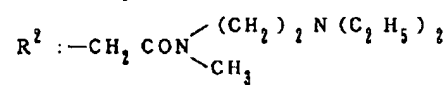
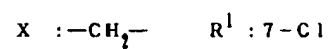
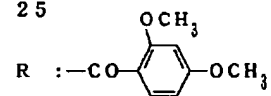
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 79)

形態 : 遊離

実施例 25

構造



結晶形 : 淡黄色不定形

NMRスペクトル : 10)

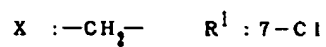
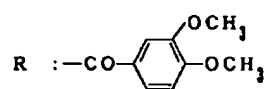
形態 : 塩酸塩

【0666】

【表68】

実施例 26

構造



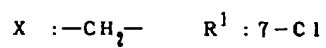
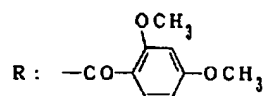
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 11)

形態 : 遊離

実施例 27

構造



結晶形 : 無色油状

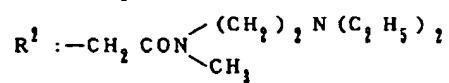
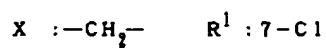
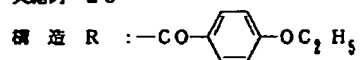
NMRスペクトル : 12)

形態 : 遊離

【0667】

【表69】

実施例 28

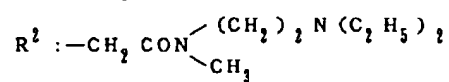
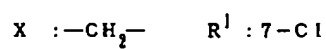
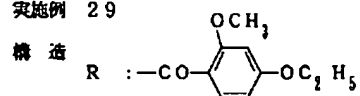


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 13)

形態 : 塩酸塩

実施例 29



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 14)

形態 : 塩酸塩

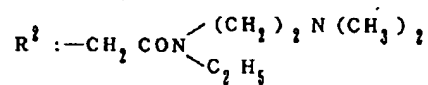
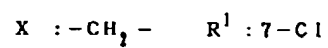
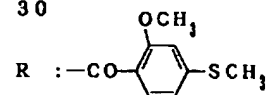
【0668】

【表70】



実施例 30

構造



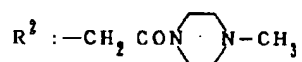
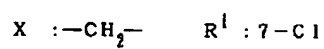
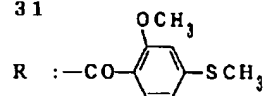
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 15)

形態 : 塩酸塩

実施例 31

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 16)

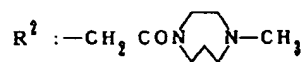
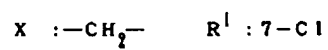
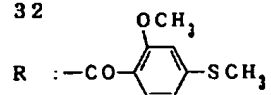
形態 : 塩酸塩

【0669】

【表71】

実施例 32

構造



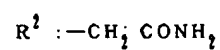
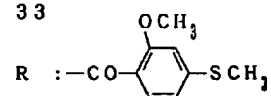
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 17)

形態 : 塩酸塩

実施例 33

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

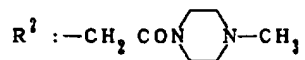
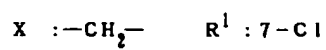
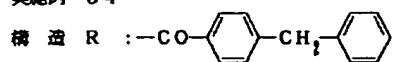
融点 : 104-108℃

形態 : 遊離

【0670】

【表72】

実施例 34

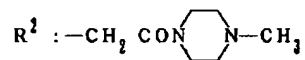
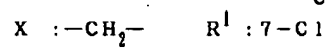
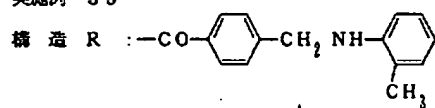


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 18)

形態 : 遊離

実施例 35



結晶形 : 無色不定形

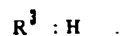
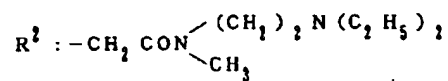
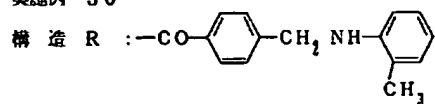
NMRスペクトル : 19)

形態 : 遊離

【0671】

【表73】

実施例 36

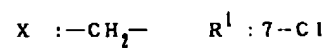
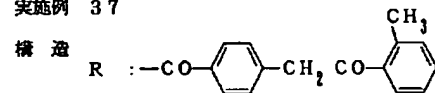


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 20)

形態 : 遊離

実施例 37



結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

融点 : 145-147℃

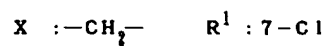
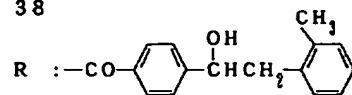
形態 : 遊離

【0672】

【表74】

実施例 38

構造



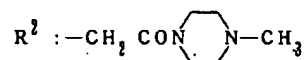
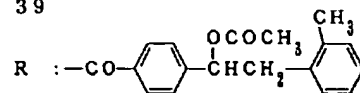
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 21)

形態 : 遊離

実施例 39

構造



結晶形 : 無色不定形

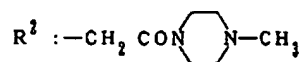
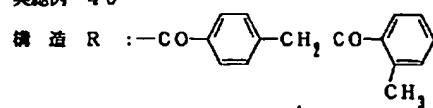
NMRスペクトル : 22)

形態 : 遊離

【0673】

【表75】

実施例 40

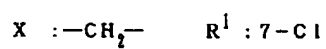
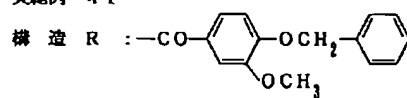


結晶形 : 淡黄色粘稠油

NMRスペクトル : 23)

形態 : 遊離

実施例 41



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

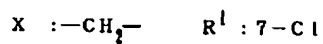
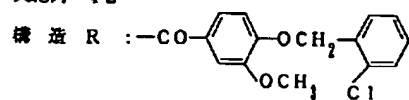
融点 : 133-133.5℃

形態 : 遊離

【0674】

【表76】

実施例 42



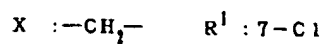
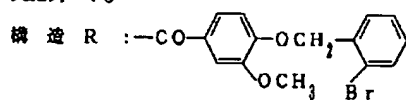
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 135℃

形 態 : 遊 離

実施例 43



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

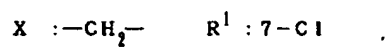
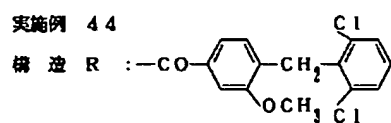
融 点 : 133℃

形 態 : 遊 離

【0675】

【表77】

実施例 44



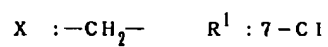
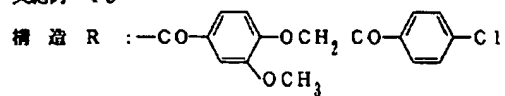
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 154℃

形態 : 遊離

実施例 45



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 166℃

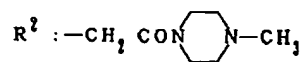
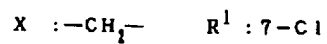
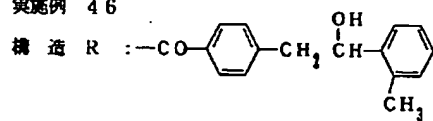
形態 : 遊離

【0676】

【表78】



実施例 46

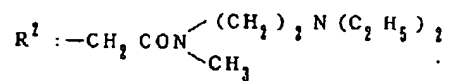
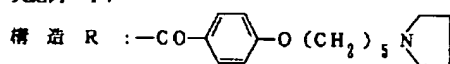


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 24)

形態 : 遊離

実施例 47



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 25)

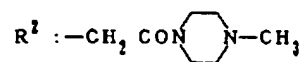
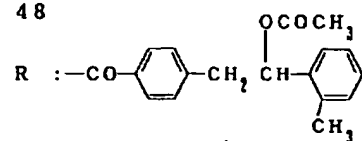
形態 : 2塩酸塩

【0677】

【表79】

実施例 48

構造



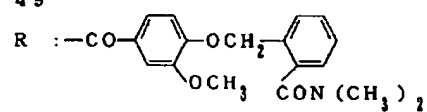
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 26)

形態 : 遊離

実施例 49

構造



結晶形 : 無色不定形

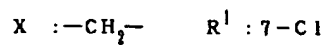
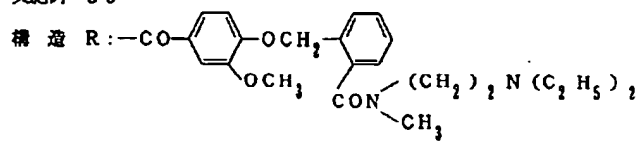
NMRスペクトル : 27)

形態 : 遊離

【0678】

【表80】

実施例 50

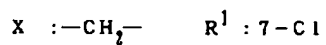
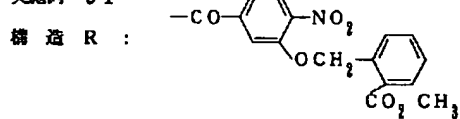


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 28)

形態 : 塩酸塩

実施例 51



結晶形 : 黄色板状晶

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 125℃

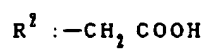
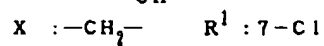
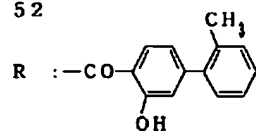
形態 : 遊離

【0679】

【表81】

実施例 52

構 造



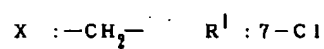
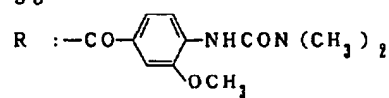
結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 80)

形 態 : 遊 離

実施例 53

構 造



結 晶 形 : 白色板状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

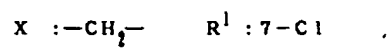
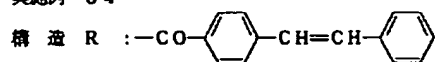
融 点 : 230-232℃

形 態 : 遊 離

【0680】

【表82】

実施例 54

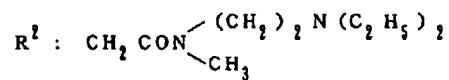
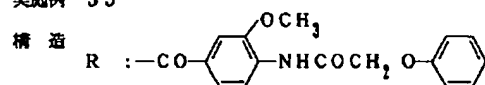


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 81)

形態 : 遊離

実施例 55



結晶形 : 無色不定形

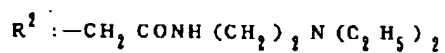
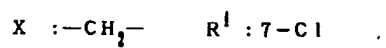
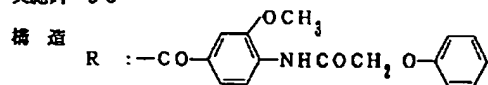
NMRスペクトル : 82)

形態 : 塩酸塩

【0681】

【表83】

実施例 56

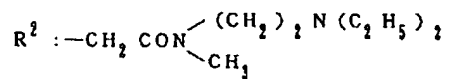
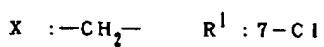
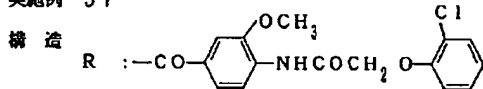


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 83)

形態 : 塩酸塩

実施例 57



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 84)

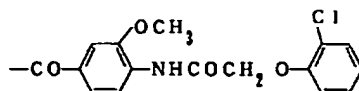
形態 : 塩酸塩

【0682】

【表84】

実施例 58

構造



$X : -CH_2-$        $R^1 : 7-Cl$

$R^2 : -CH_2 CONH(CH_2)_2 N(C_2H_5)_2$

$R^3 : H$

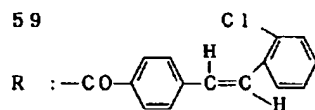
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 85)

形態 : 塩酸塩

実施例 59

構造



$X : -CH_2-$        $R^1 : 7-Cl$

$R^2 : -CH_2 CON(CH_3)(CH_2)_2 N(C_2H_5)_2$

$R^3 : H$

結晶形 : 無色粘稠油

NMRスペクトル : 29)

形態 : 遊離

【0683】

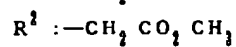
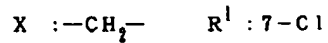
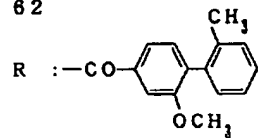
【表85】





実施例 62

構造



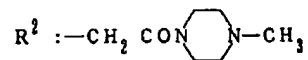
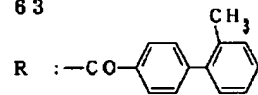
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 32)

形態 : 遊離

実施例 63

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 33)

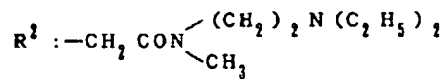
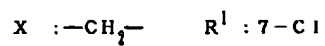
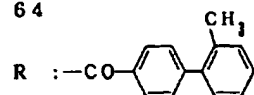
形態 : 遊離

【0685】

【表87】

実施例 64

構造



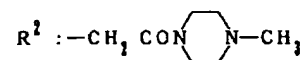
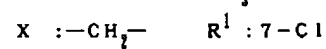
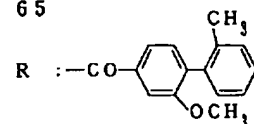
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 34)

形態 : 遊離

実施例 65

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 35)

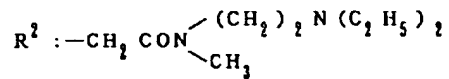
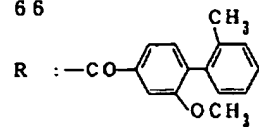
形態 : HCl

【0686】

【表88】

実施例 66

構造



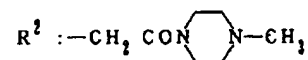
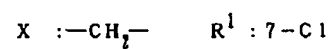
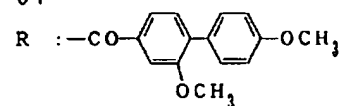
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 36)

形態 : HCl

実施例 67

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

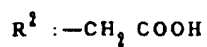
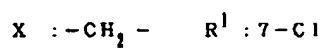
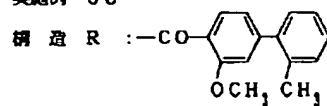
融点 : 174-176℃

形態 : 遊離

【0687】

【表89】

実施例 68



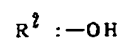
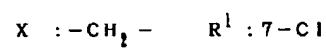
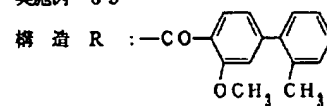
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 203-204℃

形態 : 遊離

実施例 69



結晶形 : 無色不定形

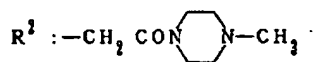
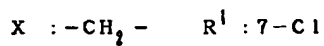
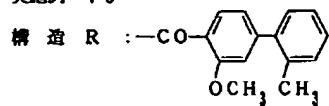
NMRスペクトル : 37)

形態 : 遊離

【0688】

【表90】

実施例 70



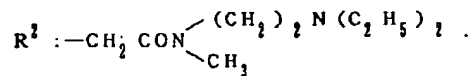
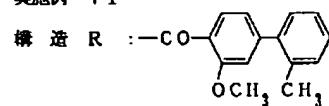
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 181-182℃

形態 : 遊離

実施例 71



結晶形 : 無色不定形

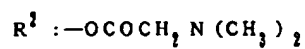
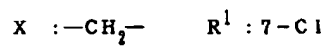
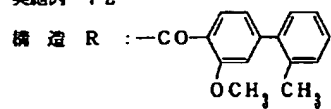
NMRスペクトル : 38)

形態 : HCl

【0689】

【表91】

実施例 72



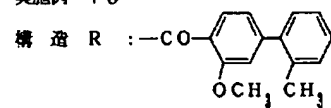
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融 点 : 153-155℃

形 態 : HCl

実施例 73



結 晶 形 : 無色不定形

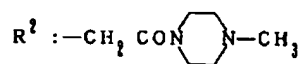
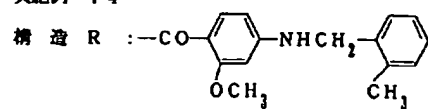
NMRスペクトル : 39)

形 態 : 遊 離

【0690】

【表92】

実施例 74



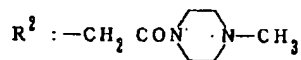
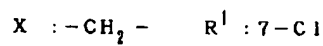
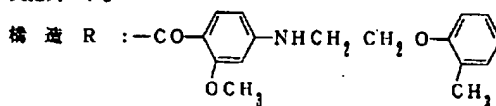
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 153-154.5℃

形態 : 遊離

実施例 75



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

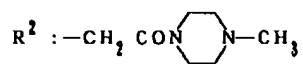
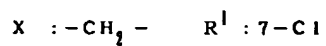
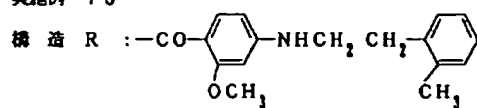
融点 : 160-161℃

形態 : 遊離

【0691】

【表93】

実施例 76



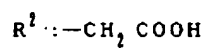
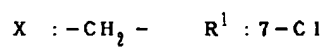
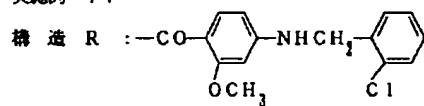
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 135-136℃

形 態 : 遊 離

実施例 77



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融 点 : 134-136.5℃

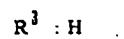
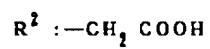
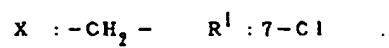
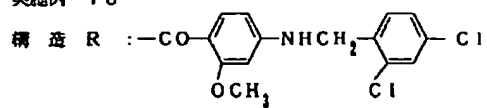
形 態 : 遊 離

【0692】

【表94】



実施例 78



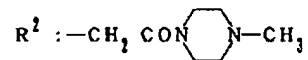
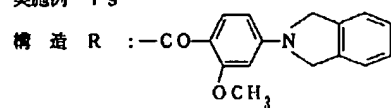
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 140.5-142℃

形態 : 遊離

実施例 79



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 199.5-202℃

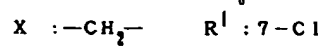
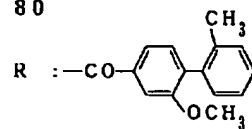
形態 : 遊離

【0693】

【表95】

実施例 80

構造



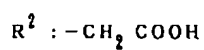
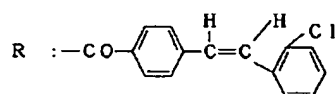
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 40)

形態 : 遊離

実施例 81

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 187-190℃

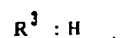
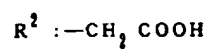
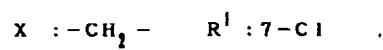
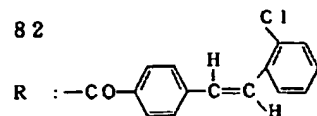
形態 : 遊離

【0694】

【表96】

実施例 82

構造



結晶形 : 白色粉末状

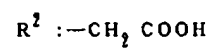
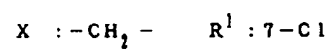
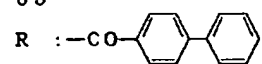
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 189-192℃

形態 : 遊離

実施例 83

構造



結晶形 : 白色粉末状

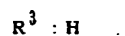
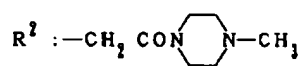
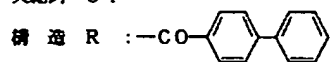
融点 : 205-207℃

形態 : 遊離

【0695】

【表97】

実施例 84

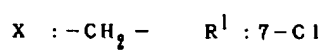
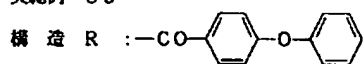


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 41)

形態 : 遊離

実施例 85



結晶形 : 無色不定形

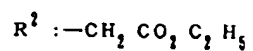
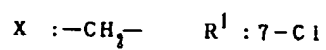
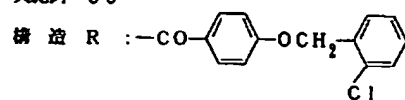
NMRスペクトル : 42)

形態 : 遊離

【0696】

【表98】

実施例 86

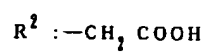
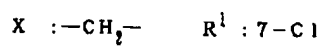
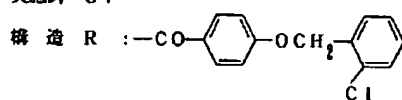


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 43)

形態 : 遊離

実施例 87



結晶形 : 無色油状

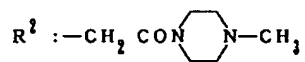
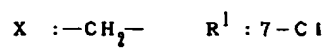
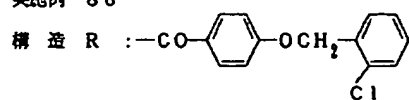
NMRスペクトル : 44)

形態 : 遊離

【0697】

【表99】

実施例 88

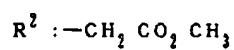
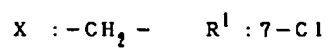
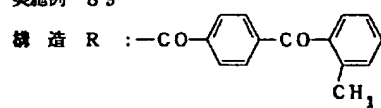


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 45)

形態 : 遊離

実施例 89



結晶形 : 無色油状

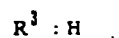
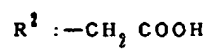
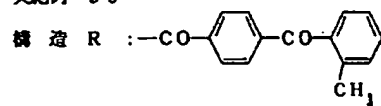
NMRスペクトル : 46)

形態 : 遊離

【0698】

【表100】

実施例 90

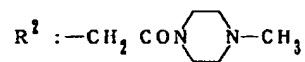
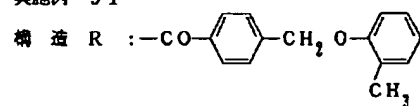


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 47)

形態 : 遊離

実施例 91



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 84-88℃

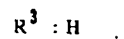
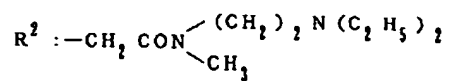
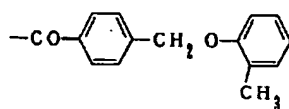
形態 : 遊離

【0699】

【表101】

実施例 92

構造



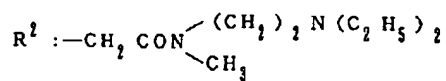
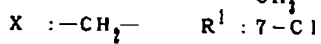
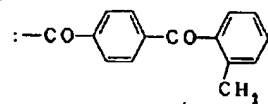
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 48)

形態 : 遊離

実施例 93

構造 R :



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 49)

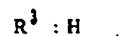
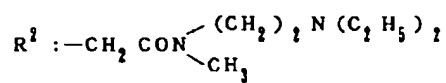
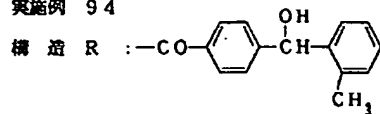
形態 : 遊離

【0700】

【表102】



実施例 94

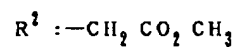
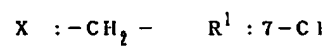
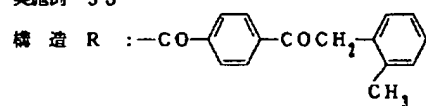


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 50)

形態 : 遊離

実施例 95



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

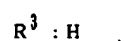
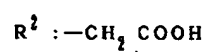
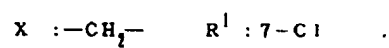
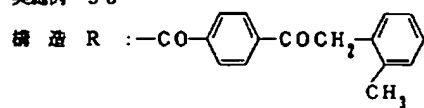
融点 : 120-122℃

形態 : 遊離

【0701】

【表103】

実施例 96

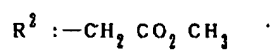
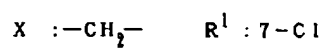
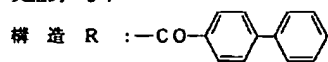


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 51)

形態 : 遊離

実施例 97



結晶形 : 無色油状

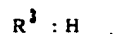
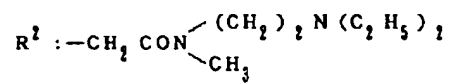
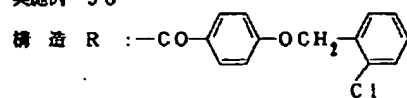
NMRスペクトル : 52)

形態 : 遊離

【0702】

【表104】

実施例 98

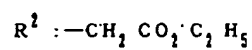
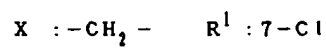
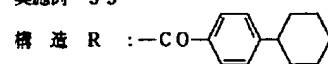


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 53)

形態 : 遊離

実施例 99



結晶形 : 無色油状

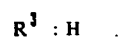
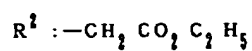
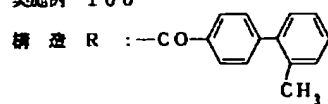
NMRスペクトル : 54)

形態 : 遊離

【0703】

【表105】

実施例 100

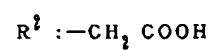
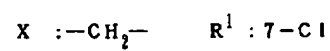
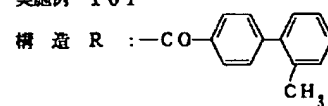


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 55)

形態 : 遊離

実施例 101



結晶形 : 無色不定形

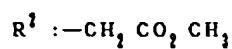
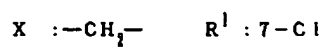
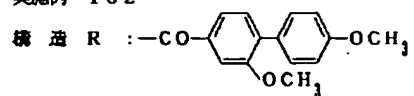
NMRスペクトル : 56)

形態 : 遊離

【0704】

【表106】

実施例 102

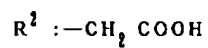
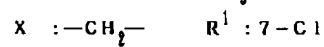
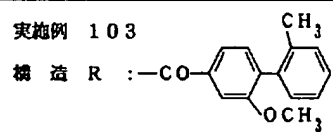


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 57)

形態 : 遊離

実施例 103



結晶形 : 無色不定形

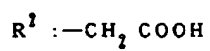
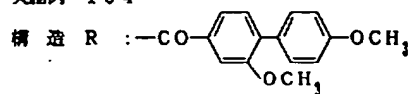
NMRスペクトル : 58)

形態 : 遊離

【0705】

【表107】

実施例 104

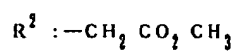
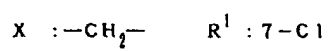
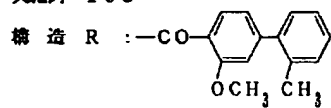


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 59)

形態 : 遊離

実施例 105



結晶形 : 無色不定形

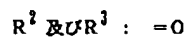
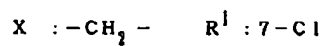
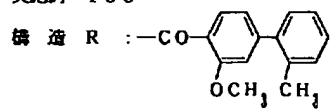
NMRスペクトル : 60)

形態 : 遊離

【0706】

【表108】

実施例 106



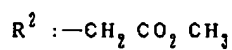
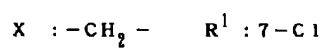
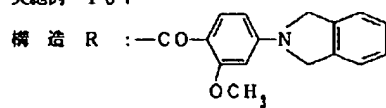
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

NMRスペクトル : 61)

形態 : 遊離

実施例 107



結晶形 : 無色不定形

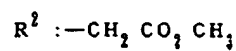
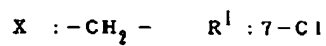
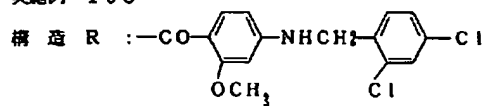
NMRスペクトル : 62)

形態 : 遊離

【0707】

【表109】

実施例 108

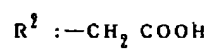
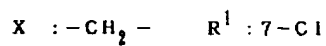
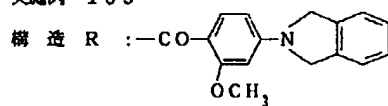


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 63)

形態 : 遊離

実施例 109



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 169-171℃

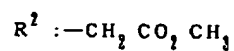
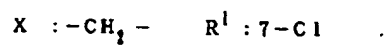
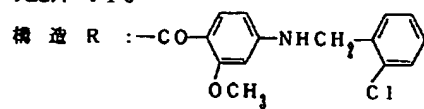
形態 : 遊離

[0708]

[表110]



実施例 110

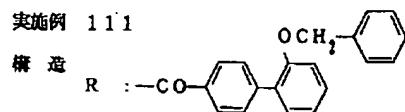


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 64)

形態 : 遊離

実施例 111



結晶形 : 無色不定形

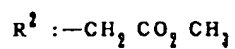
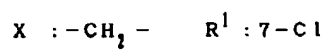
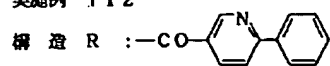
NMRスペクトル : 65)

形態 : 遊離

【0709】

【表111】

実施例 112



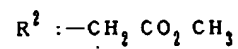
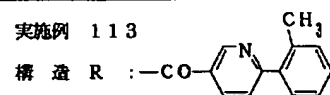
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 139.5-142℃

形態 : 遊離

実施例 113



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 6.6)

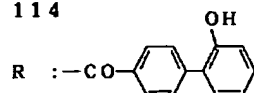
形態 : 遊離

[0710]

【表112】

実施例 114

構造



結晶形 : 白色粉末状

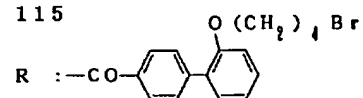
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 226℃

形態 : 遊離

実施例 115

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

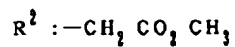
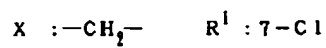
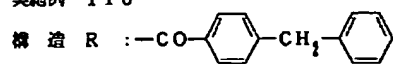
融点 : 142-142.5℃

形態 : 遊離

【0711】

【表113】

実施例 116

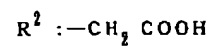
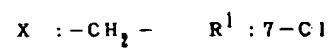
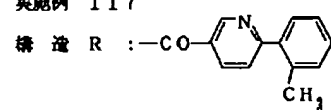


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 67)

形態 : 遊離

実施例 117



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

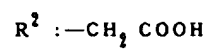
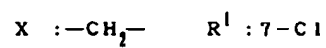
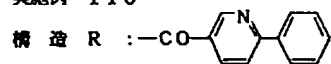
融点 : 235-237℃ (分解)

形態 : 遊離

【0712】

【表114】

実施例 118



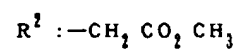
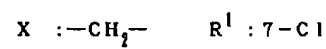
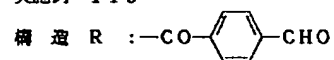
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 183℃

形態 : 遊離

実施例 119



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン


NMRスペクトル : 68)

形態 : 遊離

【0713】

【表115】

実施例 120

構造 R : -CHO

X :  $-\text{CH}_2-$        $\text{R}^1$  : 7-Cl

$\text{R}^2$  :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

$\text{R}^3$  : H


結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 192℃

形態 : 遊離

実施例 121

構造 R : -CHO

X :  $-\text{CH}_2-$        $\text{R}^1$  : 7-Cl

$\text{R}^2$  :  $-\text{CH}_2\text{CON}(\text{CH}_2)_4\text{N-CH}_3$

$\text{R}^3$  : H

結晶形 : 無色不定形


NMRスペクトル : 69)

形態 : 遊離

[0714]

[表116]

実施例 122

構造 R : 

X :  $-\text{CH}_2-$       R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2 \text{ CON} \begin{matrix} (\text{CH}_2)_2 \text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2 \\ \text{CH}_3 \end{matrix}$

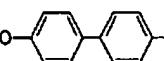
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 70)

形態 : 遊離

実施例 123

構造 R : 

X :  $-\text{CH}_2-$       R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2 \text{ CON} \begin{matrix} \text{N-C}_2\text{H}_5 \end{matrix}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 71)

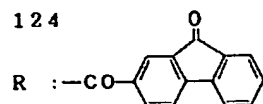
形態 : HCl

【0715】

【表117】

実施例 124

構造



結晶形 : 黄色粉末状

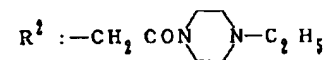
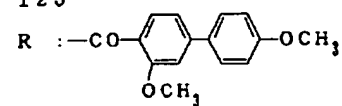
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 182-184℃

形態 : HCl

実施例 125

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 72)

形態 : HCl

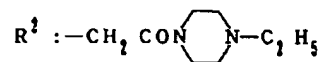
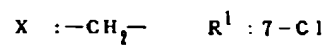
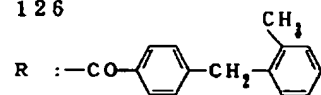
【0716】

【表118】



実施例 126

構造



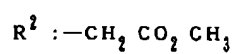
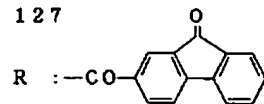
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 73)

形態 : HCl

実施例 127

構造



結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

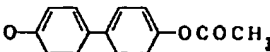
融点 : 168℃

形態 : 遊離

【0717】

【表119】

実施例 128

構造 R :  CC(=O)Oc1ccc(cc1)-c2ccc(cc2)C(=O)c3ccccc3

X :  $-\text{CH}_2-$       R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

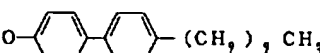
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 186-188℃

形態 : 遊離

実施例 129

構造 R :  CCCCc1ccc(cc1)-c2ccc(cc2)C(=O)c3ccccc3

X :  $-\text{CH}_2-$       R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

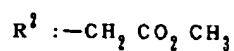
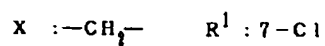
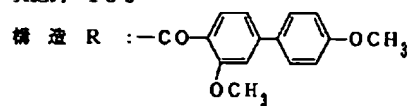
融点 : 120℃

形態 : 遊離

[0718]

[表120]

実施例 130

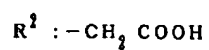
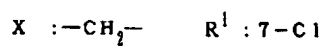
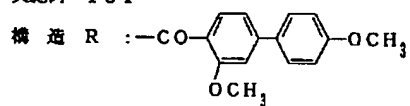


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 74)

形態 : 遊離

実施例 131



結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

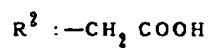
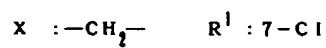
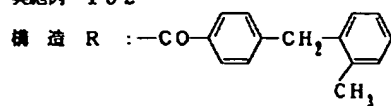
融点 : 109-111℃

形態 : 遊離

【0719】

【表121】

実施例 132

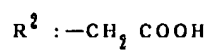
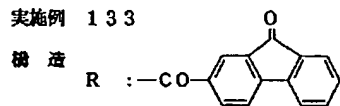


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 75)

形態 : 遊離

実施例 133



結晶形 : 黄色針状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

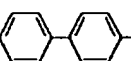
融点 : 202-203℃

形態 : 遊離

【0720】

【表122】

実施例 134

構造 R : 

X :  $-\text{CH}_2-$        $\text{R}^1 : 7\text{-Cl}$

$\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$

$\text{R}^3 : \text{H}$

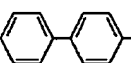
結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 :  $235^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 135

構造 R : 

X :  $-\text{CH}_2-$        $\text{R}^1 : 7\text{-Cl}$

$\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$

$\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

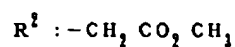
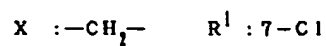
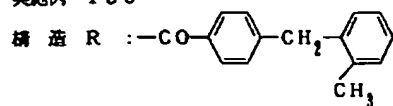
融点 :  $176^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

【0721】

【表123】

実施例 136

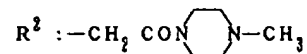
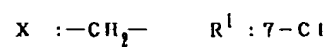
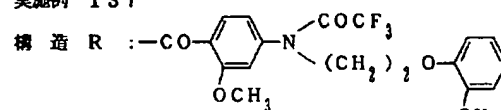


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 76)

形態 : 遊離

実施例 137



結晶形 : 無色不定形

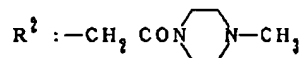
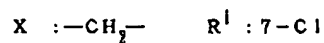
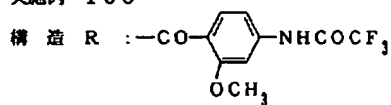
NMRスペクトル : 77)

形態 : 遊離

【0722】

【表124】

実施例 138



結晶形 : 白色粉末状

NMRスペクトル : 78)

形態 : 遊離

【0723】NMR 1) (実施例9)      2.0 (全3H, s), 3.71 (3H, s), 3.83 (3H, s), 6.51-7.18 (6H, m)。  
<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm :  
 0.78-5.25 (23H, m), 2.96及び3.      【0724】NMR 2) (実施例10)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 20-2. 25 (14H, m), 2. 30-2. 5  
5 (1H, m), 2. 60-3. 30 (3H, m),  
3. 50-3. 90 (1H, m), 4. 45-4. 60  
及び5. 10-5. 30 (1H, m), 6. 15 (1  
H, brs), 6. 59 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$   
), 6. 85-7. 00 (3H, m), 7. 10-  
7. 35 (3H, m)。

【0725】NMR 3) (实施例11)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 20-3. 40 (22H, m), 2. 21及び2.  
34 (3H, s), 3. 50-3. 90 (5H, m),  
4. 40-4. 60及び5. 05-5. 20 (1H,  
m), 6. 50-6. 60 (1H, m), 6. 85-  
6. 95 (1H, m), 7. 00-7. 15 (3H,  
m), 7. 25-7. 50 (2H, m)。

【0726】NMR 4) (实施例12)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
0. 82, 1. 02及び1. 08 (全6H, 各t,  $J=$   
7Hz), 1. 2-4. 0, 4. 35-4. 65及び  
4. 95-5. 24 (全27H, m), 6. 35-6.  
70 (1H, m), 6. 75-7. 65 (10H,  
m)。

【0727】NMR 5) (实施例15)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
0. 71-2. 24 (11H, m), 2. 25-5. 1  
7 (21H, m), 5. 71-7. 54 (9H, m)。

【0728】NMR 6) (实施例16)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
0. 78-5. 16 (32H, m), 5. 79-7. 5  
1 (10H, m)。

【0729】NMR 7) (实施例21)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 00-5. 26 (17H, m), 2. 28及び2.  
34 (各3H, 各s), 6. 54-6. 75 (1H,  
m), 6. 89-7. 93 (8H, m), 8. 48-  
8. 74 (1H, m)。

【0730】NMR 8) (实施例22)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
0. 85, 1. 00及び1. 07 (全6H, 各t,  $J=$   
7Hz), 1. 1-4. 0, 4. 35-4. 65, 4.  
65-4. 95及び4. 95-5. 25 (全27H,  
m), 6. 4-6. 65 (1H, m), 6. 75-7.  
65 (10H, m)。

【0731】NMR 9) (实施例23)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
2. 15 (3H, s), 2. 40 (3H, s), 2. 7  
1-4. 00 (7H, m), 4. 01-4. 39 (1  
H, m), 4. 69-5. 01 (1H, m), 6. 42  
-7. 55 (10H, m)。

【0732】NMR 10) (实施例25)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:  
1. 03-2. 08 (4H, m), 1. 22 (6  
H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 2. 62-4. 95 (22  
H, m), 6. 23-7. 42 (6H, m), 10. 4  
5-11. 47 (1H, m)。

【0733】NMR 11) (实施例26)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 34-1. 72 (1H, m), 1. 81-2. 25  
(3H, m), 2. 57-3. 18 (3H, m), 3.  
70 (3H, s), 3. 82 (3H, s), 4. 35-  
5. 22 (1H, m), 6. 53-6. 69 (2H,  
m), 6. 73 (1H, dd,  $J=8.4\text{Hz}$ , 1. 8  
Hz), 6. 82 (1H, d,  $J=1.8\text{Hz}$ ), 6.  
91 (1H, dd,  $J=8.4\text{Hz}$ , 2. 4Hz),  
7. 24 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ )。

【0734】NMR 12) (实施例27)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 32-2. 14 (4H, m), 2. 57-3. 20  
(3H, m), 3. 52 (3H, s), 3. 73 (3  
H, s), 4. 82-5. 05 (1H, m), 6. 16  
(1H, d,  $J=2.2\text{Hz}$ ), 6. 35 (1H, d  
d,  $J=8.4\text{Hz}$ , 2. 2Hz), 6. 64 (1H,  
d,  $J=8.2\text{Hz}$ ), 6. 81 (1H, dd,  $J=$   
8. 4Hz, 2. 4Hz), 7. 06-7. 24 (2  
H, m)。

【0735】NMR 13) (实施例28)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:  
0. 78-2. 13 (13H, m), 2. 65-  
5. 12 (13H, m), 3. 17及び3. 33 (全3  
H, s), 3. 95 (2H, q,  $J=6.8\text{Hz}$ ),  
6. 55-7. 58 (7H, m), 10. 53-11.  
48 (1H, m)。

【0736】NMR 14) (实施例29)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:  
0. 98-2. 06 (13H, m), 2. 61-  
4. 88 (21H, m), 6. 18-7. 45 (6H,  
m), 10. 42-11. 52 (1H, m)。

【0737】NMR 15) (实施例30)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:  
0. 92-1. 95 (7H, m), 2. 34-4.  
43 (14H, m), 2. 41及び2. 53 (全3H,  
s), 2. 77 (6H, s), 6. 52-7. 38 (6  
H, m), 10. 58-11. 57 (2H, m)。

【0738】NMR 16) (实施例31)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:  
0. 96-2. 03 (4H, m), 2. 33-4.  
62 (13H, m), 2. 41及び2. 53 (全3H,  
s), 2. 76 (3H, s), 3. 34 (3H, s),  
6. 52-7. 48 (6H, m), 11. 48 (1H,

brs)。

【0739】NMR 17) (实施例32)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 0.96-4.87 (22H, m), 2.40及び2.53 (全3H, s), 2.73及び2.77 (全3H, s), 6.51-7.45 (6H, m), 11.36 (1H, brs)。

【0740】NMR 18) (实施例34)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.17-5.24 (22H, m), 6.41-7.58 (12H, m)。

【0741】NMR 19) (实施例35)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.10-5.24 (26H, m), 6.32-7.69 (11H, m)。

【0742】NMR 20) (实施例36)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.74-5.24 (32H, m), 6.28-7.70 (11H, m)。

【0743】NMR 21) (实施例38)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.1-4.0, 4.35-4.65, 4.65-5.0及び5.0-5.25 (全27H, m), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-7.6 (10H, m)。

【0744】NMR 22) (实施例39)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.1-4.0, 4.35-4.7及び4.95-5.25 (全28H, m), 5.7-6.0 (1H, m), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-7.6 (10H, m)。

【0745】NMR 23) (实施例40)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.2-4.65及び4.95-5.25 (全25H, m), 6.35-6.65及び6.65-8.2 (全11H, m)。

【0746】NMR 24) (实施例46)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.2-3.95, 4.45-4.65, 4.7-4.9及び5.0-5.25 (全27H, m), 6.4-6.65及び6.75-7.6 (全11H, m)。

【0747】NMR 25) (实施例47)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 1.12-2.06 (20H, m), 2.66-4.40 (21H, m), 3.18及び3.33 (全3H, s), 6.53-7.41 (7H, m), 10.67-11.53 (2H, m)。

【0748】NMR 26) (实施例48)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.1-3.95, 4.45-4.65及び4.95-

5.25 (全29H, m), 5.7-6.05 (1H, m), 6.35-6.65 (1H, m), 6.75-7.65 (9H, m)。

【0749】NMR 27) (实施例49)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.22-2.34 (4H, m), 2.42-3.42 (3H, m), 2.82 (3H, s), 3.01 (3H, s), 3.68 (3H, s), 4.81-5.41 (1H, m), 5.08 (2H, s), 6.42-7.12 (5H, m), 7.13-7.72 (5H, m)。

【0750】NMR 28) (实施例50)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm: 0.90-2.25 (4H, m), 1.17 (6H, t,  $J=7.10\text{Hz}$ ), 2.40-3.90 (17H, m), 4.63-5.17 (1H, m), 4.98 (2H, s), 6.52-7.21 (5H, m), 7.24-7.65 (5H, m), 10.16-10.70 (1H, m)。

【0751】NMR 29) (实施例59)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.8-1.2 (6H, m), 1.2-4.0, 4.4-4.65及び5.0-5.25 (20H, m), 6.45-6.65 (1H, m), 6.6-7.75 (12H, m)。

【0752】NMR 30) (实施例60)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.8-1.15 (6H, m), 1.15-3.95, 4.35-4.65及び4.95-5.25 (全20H, m), 2.96, 3.17 (各s), 6.4-7.6 (13H, m)。

【0753】NMR 31) (实施例61)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.06-2.41 (7H, m), 2.31 (3H, s), 2.51-4.38 (16H, m), 4.51-4.92 (2H, m), 6.53-7.52 (10H, m), 12.52-12.94 (1H, m)。

【0754】NMR 32) (实施例62)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.13-2.26 (5H, m), 2.02 (3H, s), 2.58-5.29 (7H, m), 3.69 (3H, s), 6.49-7.45 (10H, m)。

【0755】NMR 33) (实施例63)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.15-5.29 (17H, m), 2.16 (3H, s), 2.34 (3H, s), 6.47-7.62 (11H, m)。

【0756】NMR 34) (实施例64)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.70-1.19 (6H, m), 1.20-5.25 (20H, m), 2.16 (3H, m), 6.48-



7. 62 (1H, m)。

【0757】NMR 35) (实施例65)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 02-5. 28 (23H, m), 2. 02 (3H, s), 6. 52-7. 50 (10H, m), 11. 68-12. 41 (1H, m)。

【0758】NMR 36) (实施例66)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 04-5. 32 (29H, m), 2. 02 (3H, s), 6. 48-7. 51 (10H, m), 11. 87-12. 28 (1H, m)。NMR 37) (实施例69)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 46-2. 41 (4H, m), 2. 14 (3H, s), 2. 68-2. 98 (1H, m), 3. 27-3. 83 (4H, m), 4. 68-5. 27 (2H, m), 6. 47-7. 54 (9H, m), 7. 60 (1H, d,  $J=2. 16\text{Hz}$ )。

【0759】NMR 38) (实施例71)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
0. 86-5. 20 (32H, m), 6. 51-7. 52 (10H, m), 11. 62-12. 24 (1H, m)。

【0760】NMR 39) (实施例73)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 28-2. 28 (4H, m), 2. 14 (3H, s) 2. 58-2. 92 (2H, m), 2. 93-3. 28 (1H, m), 3. 58 (3H, s), 4. 82-5. 12 (1H, m), 6. 56 (1H, s), 6. 65-6. 96 (3H, m), 6. 97-7. 48 (6H, m)。

【0761】NMR 40) (实施例80)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 21-2. 25 (4H, m), 2. 01 (3H, s), 2. 26-3. 20 (3H, m), 3. 59 (3H, s), 4. 86-5. 22 (1H, m), 6. 42-7. 45 (10H, m)。

【0762】NMR 41) (实施例84)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 1-4. 0, 4. 35-4. 65及び5. 0-5. 25 (全20H, m, 2. 34 (s)), 6. 45-6. 7 (1H, m), 6. 91 (1H, dd,  $J=2\text{Hz}$ , 8Hz), 7. 05 (1H, d,  $J=2\text{Hz}$ ), 7. 15-7. 7 (9H, m)。

【0763】NMR 42) (实施例85)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 2-3. 95, 4. 35-4. 65, 5. 0-5. 25 (全20H, m, 2. 33 (s)), 6. 4-7. 55 (12H, m, 6. 59 (d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6. 79 (d,  $J=8. 5\text{Hz}$ ))。

【0764】NMR 43) (实施例86)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 1-2. 2 (7H, m), 2. 45-3. 3, 3. 35-3. 9, 4. 0-4. 35, 4. 35-4. 65及び4. 95-5. 35 (全9H, m, 5. 09 (s)), 6. 45-6. 65 (1H, m), 6. 77 (2H, d,  $J=8. 5\text{Hz}$ ), 6. 92 (1H, d,  $J=2\text{Hz}$ , 8. 5Hz), 7. 05-7. 6 (7H, m)。

【0765】NMR 44) (实施例87)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 15-2. 2 (4H, m), 2. 5-3. 3, 3. 35-3. 9, 4. 3-4. 6及び4. 9-5. 3 (全7H, m, 5. 06 (s)), 4. 45-6. 65 (1H, m), 6. 74 (2H, d,  $J=8. 5\text{Hz}$ ), 6. 93 (1H, dd,  $J=2\text{Hz}$ , 8. 5Hz), 7. 12 (1H, d,  $J=2\text{Hz}$ ), 7. 12-7. 55 (6H, m)。

【0766】NMR 45) (实施例88)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 15-2. 85, 2. 85-4. 0, 4. 35-4. 65及び4. 9-5. 35 (全22H, 2. 33, 5. 10 (各s)), 6. 4-6. 65 (1H, m), 6. 80 (2H, d,  $J=8. 5\text{Hz}$ ), 6. 92 (1H, dd,  $J=2\text{Hz}$ , 8. 5Hz), 7. 04 (1H, d,  $J=2\text{Hz}$ ), 7. 04-7. 6 (6H, m)。

【0767】NMR 46) (实施例89)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 20-2. 45 (7H, m, 2. 27 (s)), 2. 5-3. 1, 3. 1-3. 4, 3. 4-3. 9, 4. 35-4. 65及び5. 02-5. 30 (全8H, m, 3. 72 (s)), 6. 56 (1H, d,  $J=8. 3\text{Hz}$ ), 6. 92 (1H, dd,  $J=2. 3\text{Hz}$ , 8. 4Hz), 7. 10 (1H, d,  $J=2. 2\text{Hz}$ ), 7. 10-7. 71 (8H, m)。

【0768】NMR 47) (实施例90)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
1. 23-2. 47 (4H, m), 2. 26 (3H, s), 2. 6-3. 05 (2H, m), 3. 10-3. 43, 3. 48-3. 90, 4. 35-4. 62及び5. 05-5. 29 (全3H, m), 6. 56 (1H, d,  $J=8. 3\text{Hz}$ ), 6. 90 (1H, dd,  $J=2. 2\text{Hz}$ , 8. 3Hz), 7. 08 (1H, d,  $J=2. 2\text{Hz}$ ), 7. 12-7. 55 (6H, m), 7. 61 (2H, d,  $J=8. 5\text{Hz}$ )。

【0769】NMR 48) (实施例92)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:  
0. 84, 1. 05及び1. 08 (全6H, 各t,  $J=7\text{Hz}$ ), 1. 2-4. 0, 4. 1-4. 7及び4. 8

-5.3 (全25H, m, 2.24 (s)), 2.61 (q, J=7Hz), 2.99, 3.19 (各s)), 6.4-7.7 (11H, m, 6.55 (d, J=8Hz))。

【0770】NMR 49) (实施例93)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 0.90, 0.97及び1.07 (全6H, 各t, J=7Hz), 1.15-4.02, 4.38-4.65及び4.95-5.25 (全23H, m, 2.26, 3.18 (各s)), 6.54 (1H, d, J=8.3Hz), 6.77-7.70 (10H, m)。

【0771】NMR 50) (实施例94)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 0.82, 1.00及び1.07 (全6H, 各t, J=7Hz), 1.15-3.98, 4.47-4.68, 4.95-5.22及び5.75-6.10 (全25H, m), 6.40-6.68及び6.73-7.68 (全11H, m)。

【0772】NMR 51) (实施例96)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.2-2.4 (4H, m), 2.20 (3H, s), 2.5-3.35, 3.4-3.9, 4.25-4.6及び4.9-6.2 (全8H, m, 4.22 (s)), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-6.95 (1H, m), 6.95-7.35 (5H, m), 7.42 (2H, d, J=8.5Hz), 7.81 (2H, d, J=8.5Hz)。

【0773】NMR 52) (实施例97)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.2-2.3, 2.5-3.4, 3.5-4.3, 4.35-4.7及び5.05-5.35 (全12H, 3.75 (s)), 6.4-6.7 (1H, m), 6.93 (1H, dd, J=2Hz, 8.5Hz), 7.13 (1H, d, J=2Hz), 7.2-7.8 (9H, m)。

【0774】NMR 53) (实施例98)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 0.85, 1.03及び1.08 (全6H, 各t, J=7Hz), 1.2-4.0, 4.3-4.65及び4.9-5.3 (全22H, 2.99, 3.19, 5.10 (各s)), 6.45-7.6 (11H, m)。

【0775】NMR 54) (实施例99)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.27 (3H, t, J=7.1Hz), 1.20-2.20 (14H, m), 2.30-2.50 (1H, m), 2.60-3.05 (3H, m), 3.10-3.35 (1H, m), 4.10-4.40 (2H, m), 4.45-4.65 (1H, m), 6.57 (1H, d, J=8.4Hz), 6.96 (1H, d, J=8.1Hz), 7.00 (2H, d, J=8.0H

z), 7.10-7.35 (3H, m)。

【0776】NMR 55) (实施例100)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.08-2.41 (5H, m), 1.25 (3H, t, J=7.10Hz), 2.16 (3H, s), 2.54-5.32 (6H, m), 6.48-7.54 (11H, m)。

【0777】NMR 56) (实施例101)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.14-2.36 (5H, m), 2.26 (3H, s), 2.51-5.35 (4H, m), 6.45-7.50 (11H, m), 8.65-13.90 (1H, m)。

【0778】NMR 57) (实施例102)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.18-2.39 (5H, m), 2.57-3.05 (2H, m), 3.09-5.28 (2H, m), 3.67, 3.72及び3.82 (各3H, 各s), 6.48-7.81 (10H, m)。

【0779】NMR 58) (实施例103)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.14-2.26 (4H, m), 2.01 (3H, s), 2.52-3.10 (2H, m), 3.01-5.28 (3H, m), 3.61 (3H, s), 6.48-7.88 (10H, m), 8.50-13.9 (1H, m)。

【0780】NMR 59) (实施例104)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.18-2.32 (4H, m), 2.57-3.09 (2H, m), 3.10-5.29 (3H, m), 3.66及び3.81 (各3H, 各s), 6.45-7.80 (10H, m), 8.03-13.80 (1H, m)。

【0781】NMR 60) (实施例105)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.13-2.37 (4H, m), 2.14 (3H, s), 2.54-2.97 (2H, m), 2.98-5.20 (3H, m), 3.68及び3.74 (各3H, 各s), 6.50-7.52 (10H, m)。

【0782】NMR 61) (实施例106)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.41-4.06 (5H, m), 2.13 (3H, s), 3.39 (3H, s), 4.36-5.41 (1H, m), 6.49 (1H, s), 6.79 (1H, d, J=8.44Hz), 6.88 (1H, d, J=7.42Hz), 7.01-7.62 (6H, m), 7.79 (1H, d, J=2.24Hz)。

【0783】NMR 62) (实施例107)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.10-2.21 (5H, m), 2.51-3.26

(3H, m), 3.27-4.11 (4H, m), 3.77 (3H, s), 4.36-4.88 (4H, m), 5.71-7.58 (10H, m)。

【0784】NMR 63) (实施例108)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.06-2.21 (4H, m), 2.49-5.23 (11H, m), 3.73 (3H, s), 5.78-7.50 (9H, m)。

【0785】NMR 64) (实施例110)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.04-2.26 (4H, m), 2.47-5.20 (14H, m), 5.58-7.72 (10H, m)。

【0786】NMR 65) (实施例111)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.31-1.69 (1H, m), 1.70-2.24 (3H, m), 2.55-3.20 (3H, m), 4.88-5.20 (1H, m), 5.03 (2H, s), 6.51-7.51 (16H, m)。

【0787】NMR 66) (实施例113)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.15-2.40 (4H, m), 2.28 (3H, s), 2.60-5.29 (5H, m), 3.74 (3H, s), 6.54-6.78 (1H, m), 6.88-7.06 (1H, m), 7.09-7.46 (6H, m), 7.58-7.79 (1H, m), 8.46-8.66 (1H, m)。

【0788】NMR 67) (实施例116)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.10-2.30 (4H, m), 2.49-5.29 (5H, m), 3.70 (3H, s), 3.87 (2H, s), 6.41-7.75 (12H, m)。

【0789】NMR 68) (实施例119)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: ( $\text{CDCl}_3$ ): 1.21-2.31 (4H, m), 2.60-5.27 (5H, m), 3.75 (3H, s), 6.41-6.63 (1H, m), 6.80-7.53 (2H, m), 7.48 (2H, d,  $J=8.24\text{Hz}$ ), 7.74 (2H, d,  $J=8.42\text{Hz}$ ), 9.99-10.02 (1H, m)。

【0790】NMR 69) (实施例121)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.16-5.23 (17H, m), 2.35 (3H, s), 6.41-6.62 (1H, m), 6.78-7.53 (2H, m), 7.61 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.73 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 9.94 (1H, s)。

【0791】NMR 70) (实施例122)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.90-5.24 (26H, m), 6.40-6.61 (1H, m), 6.74-7.82 (6H, m),

9.88-10.01 (1H, m)。

【0792】NMR 71) (实施例123)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.94 (3H, t,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 0.78-5.25 (26H, m), 6.48-7.82 (11H, m), 12.35-13.74 (1H, m)。

【0793】NMR 72) (实施例125)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.85-5.23 (28H, m), 6.37-7.80 (10H, m), 12.29-13.40 (1H, m)。

【0794】NMR 73) (实施例126)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.02-5.22 (27H, m), 6.37-7.76 (11H, m), 12.54-13.50 (1H, m)。

【0795】NMR 74) (实施例130)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.08-2.37 (4H, m), 2.51-5.45 (11H, m), 3.83 (3H, s), 6.34-7.62 (10H, m)。

【0796】NMR 75) (实施例132)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.11-2.32 (4H, m), 2.12 (3H, s), 2.41-5.30 (7H, m), 6.38-8.08 (11H, m), 8.91-13.00 (1H, m)。

【0797】NMR 76) (实施例136)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.03-2.36 (4H, m), 2.13 (3H, s), 2.38-5.28 (7H, m), 3.71 (3H, s), 6.41-8.09 (11H, m)。

【0798】NMR 77) (实施例137)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.05-5.10 (25H, m), 6.05-7.50 (15H, m)。

【0799】NMR 78) (实施例138)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.03-5.08 (20H, m), 2.34 (3H, s), 6.58-7.53 (6H, m), 8.39-9.04 (1H, m)。

【0800】NMR 79) (实施例24)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 0.78-5.25 (23H, m), 2.96及び3.20 (全3H, s), 3.71 (3H, s), 3.83 (3H, s), 6.51-7.18 (6H, m)。

【0801】NMR 80) (实施例52)

$^1\text{H-NMR}$  (200MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.12-2.36 (4H, m), 2.20 (3H, s), 2.56-4.00 (4H, m), 4.25-

5. 41 (1H, m), 6. 27-7. 76 (11H, m), 10. 73-11. 74 (1H, m)。

【0802】NMR 81) (実施例54)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1. 3-1. 7 (1H, m), 1. 7-2. 2 (3H, m), 2. 55-3. 2 (3H, m), 4. 85-5. 2 (1H, m), 6. 3-7. 7 (14H, m)。

【0803】NMR 82) (実施例55)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 1. 07-2. 04 (10H, m), 2. 58-3. 98 (18H, m), 4. 13-4. 36 (1H, m), 4. 73 (2H, s), 6. 61-7. 43 (10H, m), 7. 87-8. 01 (1H, m), 9. 21 (1H, s), 10. 32 (1H, brs)。

【0804】NMR 83) (実施例56)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 1. 05-2. 06 (10H, m), 2. 43-3. 80 (15H, m), 4. 17-4. 40 (1H, m), 4. 73 (2H, m), 6. 63-7. 48 (10H, m), 7. 84-7. 98 (1H, m), 8. 56-8. 71 (1H, m), 9. 22 (1H, s), 10. 34 (1H, brs)。

【0805】NMR 84) (実施例57)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 1. 08-2. 02 (10H, m), 2. 62-3. 99 (18H, m), 4. 12-4. 39 (1H, m), 4. 82 (2H, s), 6. 61-7. 57 (9H, m), 7. 96-8. 11 (1H, m), 9. 33 (1H, s), 10. 21 (1H, brs)。

【0806】NMR 85) (実施例58)

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 1. 04-2. 01 (10H, m), 2. 43-3. 80 (15H, m), 4. 13-4. 40 (1H, m), 4. 82 (2H, s), 6. 60-7. 53 (9H, m), 7. 92-8. 08 (1H, m), 8. 56-8. 71 (1H, m), 9. 33 (1H, s), 10. 35 (1H, brs)。

【0807】実施例139

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{N-[2-(2-メチルフェノキシ)エチル]-N-トリフルオロアセチルアミノ}ベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0. 45gのメタノール20ml溶液に、炭酸カリウム0. 11gの水溶液5mlを加え室温にて12時間攪拌した。メタノールを大半留去し、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。溶媒を乾燥後、減圧留去した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=80: 1→50: 1→30: 1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにて再結晶して、0. 12gの7-

クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{2-(2-メチルフェノキシ)エチルアミノ}ベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0808】白色粉末状、mp: 160-161℃。

【0809】実施例140

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-トリフルオロアセチルアミノベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0. 4gの乾燥テトラヒドロフラン20ml溶液へ、トリフェニルホスフィン0. 54g、o-(2-ヒドロキシエトキシ)トルエン0. 29gを室温にて加え、次にジエチルアゾジカルボキシレート0. 32mlの乾燥テトラヒドロフラン5ml溶液を滴下し、室温にて16時間攪拌した。水を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。エーテル層を乾燥後、溶媒留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=50: 1→30: 1)に付し、0. 46gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{N-[2-(2-メチルフェノキシ)エチル]-N-トリフルオロアセチルアミノ}ベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0810】無色不定形

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1. 05~5. 10 (25H, m), 6. 05-7. 50 (15H, m)。

【0811】適当な出発原料を用い、実施例140と同様にして前記実施例13~16、74~78、108及び110の化合物を得た。

【0812】実施例141

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2. 0gのピリジン30ml溶液へ、氷冷下、無水トリフルオロ酢酸1. 14mlを滴下した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。水洗乾燥後、留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=50: 1→30: 1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにより結晶化し、1. 86gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-トリフルオロアセチルアミノベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0813】白色粉末状

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1. 03~5. 08 (20H, m), 2. 34 (3H,

s), 6.58~7.53 (6H, m), 8.39~9.04 (1H, m)。

【0814】適当な出発原料を用い、実施例141と同様にして前記実施例7、8及び55~58の化合物を得た。

【0815】実施例142

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.8gのメタノール30ml溶液へ、o-トルアルデヒド0.35ml及び酢酸1mlを加え、50~60℃で2~3時間攪拌後、水素化シアノホウ素ナトリウム0.11gを室温にて加え、2時間攪拌した。メタノールを減圧留去し、水を加えて酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を乾燥後留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=50:1→25:1)に付し、アセトン-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.71gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-(2-メチルベンジルアミノ)ベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0816】白色粉末状、mp:153-154.5℃。

【0817】適当な出発原料を用い、実施例142と同様にして前記実施例13~16、75~78、108、110及び137の化合物を得た。

【0818】実施例143

7-クロロ-5-メトキシカルボニルメチル-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2.6gのエタノール100ml懸濁液に炭酸ナトリウム1.5g、o-キシレンジブromaid1.87g及び沃化ナトリウム2.42gを加え、60~70℃にて、3時間攪拌した。エタノールを減圧留去し、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を乾燥後、減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10→1:5)に付し、0.32gの7-クロロ-5-メトキシカルボニルメチル-1-(2-メトキシ-4-(2-イソインドリニル)ベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0819】無色不定形

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.10-2.21 (5H, m), 2.51-3.26 (3H, m), 3.27-4.11 (4H, m), 3.77 (3H, s), 4.36-4.88 (4H, m), 5.71-7.58 (10H, m)。

【0820】実施例143と同様にして適当な出発原料を用いて前記実施例79、及び101の化合物を得た。

【0821】実施例144

7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-ヒドロキシベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.7gの乾燥ジメチルホルムアミド20ml溶液へ、炭酸カリウム0.35g及び2-クロロベンジルクロリド0.32mlを加え、室温にて一晩攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。水洗乾燥後、溶媒留去し、アセトン-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.76gの7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-(2-クロロベンジルオキシ)ベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0822】白色粉末状、mp:135℃。

【0823】適当な出発原料を用い、実施例144と同様にして前記実施例24~33、41、43~45、47、49~51、86~88及び98の化合物を得た。

【0824】実施例145

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-ホルミルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.29gのメタノール30ml溶液に、o-トルイジン0.2ml及び酢酸をpH4になるまで加え、50℃で8時間加熱攪拌後、氷冷下、水素化シアノホウ素ナトリウム0.085gを加え、1時間攪拌した。メタノールを減圧留去後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。水洗乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=100:1→50:1)に付し、0.1gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-(2-メチルアニリノメチル)ベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0825】無色不定形

<sup>1</sup>H-NMR (200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.10-5.24 (26H, m), 6.32-7.69 (11H, m)。

【0826】適当な出発原料を用い、実施例145と同様にして前記実施例36の化合物を得た。

【0827】実施例146

7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.7gのピリジン5ml溶液に、N,N-ジメチルカルバミン酸クロリド0.42mlを加え、60~70℃にて、2時間攪拌した。塩酸酸性とし、酢酸エチルにて抽出した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10→1:1→3:1)に付し、エタノール-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.33gの7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-ジメチルアミノカルボニルアミノ

ベンゾイル) -2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-  
ベンゾアゼピンを得た。

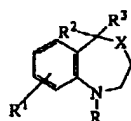
【0828】mp : 230~232℃、白色板状。

【0829】適当な出発原料を用い、実施例1及び2と

同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【0830】

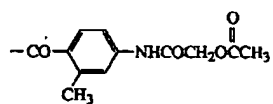
【表125】



実施例 147

構造

R :



X : -CH<sub>2</sub>- R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

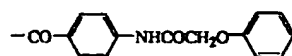
【0831】

【表126】

实施例 148

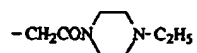
構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$  R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



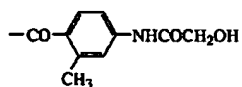
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 149

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$  R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
融点 : 194 - 195℃  
形態 : 遊離

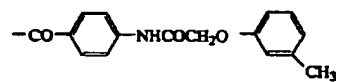
【0832】

【表127】

實施例 150

構造

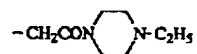
R :



X :  $\text{--CH}_2\text{--}$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



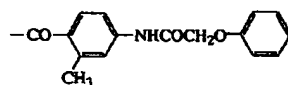
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 151

構造

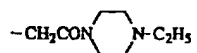
R :



X :  $\text{--CH}_2\text{--}$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0833】

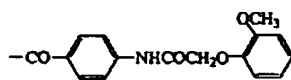
【表128】



実施例 152

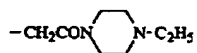
構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$       R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 153

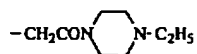
構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$       R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

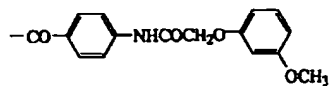
【0834】

【表129】

实施例 154

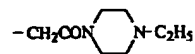
構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$  R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



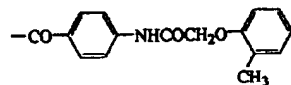
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 155

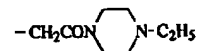
構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$  R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0835】

【表130】

實施例 156

構造

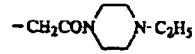
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



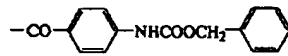
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 157

構造

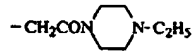
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

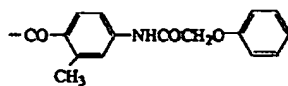
【0836】

【表131】

實施例 158

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



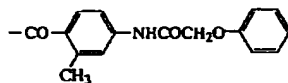
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 159

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

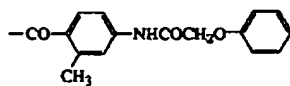
【0837】

【表132】

实施例 160

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

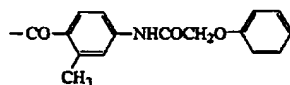
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 161

構造

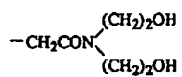
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

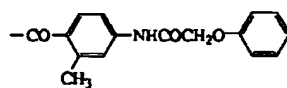
【0838】

【表133】

实施例 162

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$

R<sup>3</sup> : H

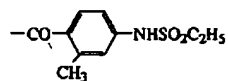
結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

实施例 163

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

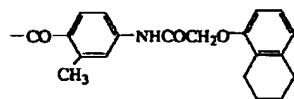
【0839】

【表134】

实施例 164

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

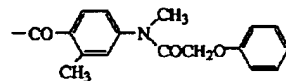
融点 : 230 - 232℃ (分解)

形態 : 遊離

实施例 165

構造

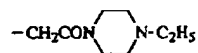
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

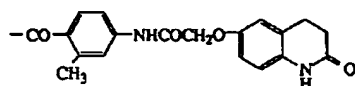
【0840】

【表135】

实施例 166

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

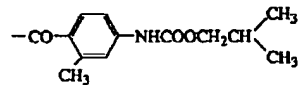
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
融点 : 243 - 245℃ (分解)  
形態 : 遊離

实施例 167

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0841】

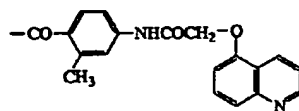
【表136】



实施例 168

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

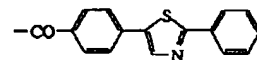
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 淡黄色粉末状  
融点 : 203 - 205℃ (分解)  
形態 : 遊離

实施例 169

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 褐色粉末状  
融点 : 178 - 180℃  
形態 : 遊離

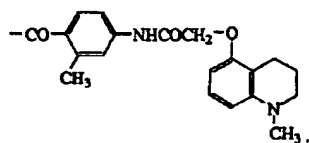
【0842】

【表137】

实施例 170

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

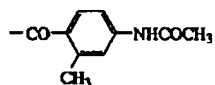
融点 : 202 - 204℃ (分解)

形態 : 遊離

实施例 171

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 118 - 120℃

形態 : 遊離

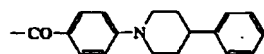
【0843】

【表138】

实施例 172

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

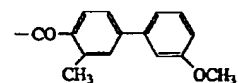
融点 : 179 - 181°C (分解)

形態 : 遊離

实施例 173

構造

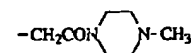
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

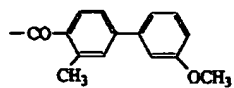
【0844】

【表139】

実施例 174

構造

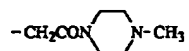
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



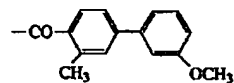
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 175

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0845】

【表140】

实施例 176

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 177

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

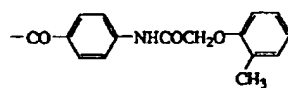
【0846】

【表141】

实施例 178

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 179

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

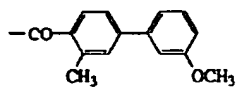
【0847】

【表142】

实施例 180

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

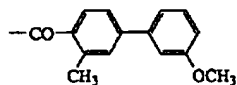
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 181

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

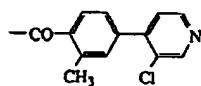
【0848】

【表143】

实施例 182

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

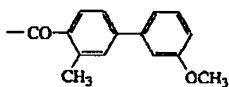
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 淡黄色油状  
形態 : 遊離

实施例 183

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0849】

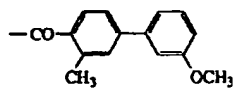
【表144】



实施例 184

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

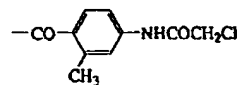
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 185

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

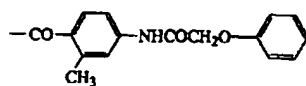
【0850】

【表145】

实施例 186

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

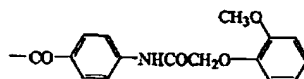
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 187

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

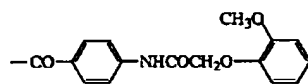
【0851】

【表146】

實施例 188

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

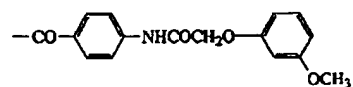
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 189

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

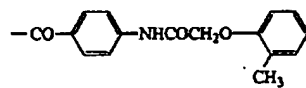
【0852】

【表147】

实施例 190

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

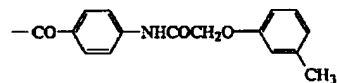
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 191

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 130 - 132℃

形態 : 遊離

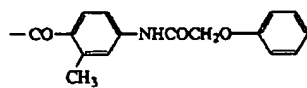
【0853】

【表148】

實施例 192

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 193

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0854】

【表149】

实施例 194

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

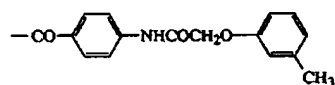
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 195

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

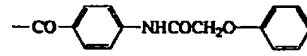
【0855】

【表150】

实施例 196

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

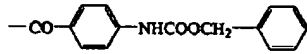
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 197

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

【0856】

【表151】

實施例 198

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

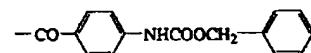
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 199

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末狀  
形態 : 遊離

【0857】

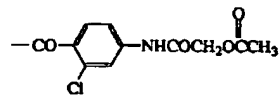
【表152】



実施例 200

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

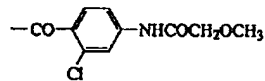
融点 (°C) : 188 - 190

形態 : 遊離

実施例 201

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

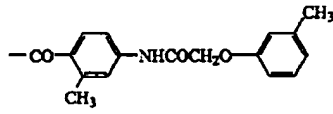
【0858】

【表153】

實施例 202

構造

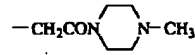
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



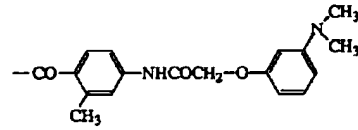
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

實施例 203

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

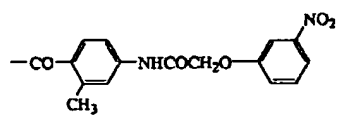
【0859】

【表154】

実施例 204

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

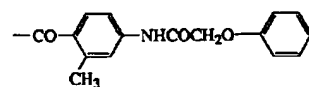
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : エタノール  
融点 : 186.5 - 188℃  
形態 : 遊離

実施例 205

構造

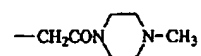
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

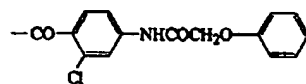
【0860】

【表155】

实施例 206

構造

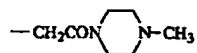
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



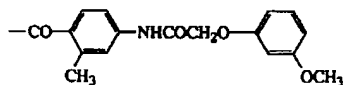
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 黄色不定形  
形態 : HCl

实施例 207

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

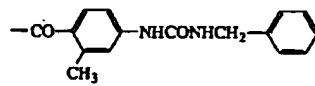
【0861】

【表156】

实施例 208

構造

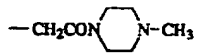
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



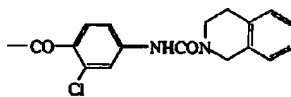
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 209

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

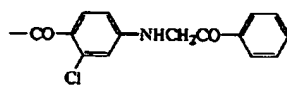
【0862】

【表157】

实施例 210

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

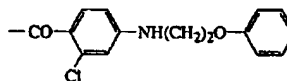
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 211

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

【0863】

【表158】

実施例 212

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

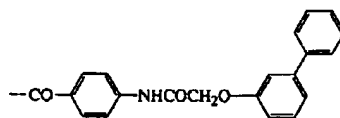
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色針状  
再結晶溶媒 : 酢酸エチル  
融点 : 204 - 205℃  
形態 : 遊離

実施例 213

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色プリズム状  
再結晶溶媒 : 酢酸エチル  
融点 : 157.5 - 159℃  
形態 : 遊離

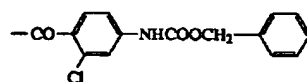
【0864】

【表159】

実施例 214

構造

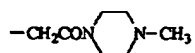
R :



X : -CH<sub>2</sub>-

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

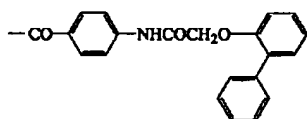
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 215

構造

R :



X : -CH<sub>2</sub>-

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 168 - 169.5℃

形態 : 遊離

【0865】

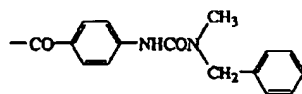
【表160】



実施例 216

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

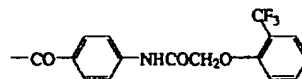
融点 : 177 - 178℃

形態 : 遊離

実施例 217

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル洗淨

融点 : 195.5 - 197℃

形態 : 遊離

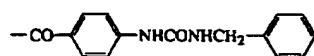
【0866】

【表161】

実施例 218

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

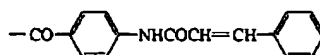
融点 : 177 - 178℃

形態 : 遊離

実施例 219

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル- n-ヘキサン洗浄

融点 : 234 - 234.5℃

形態 : 遊離

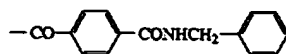
【0867】

【表162】

実施例 220

構造

R :



X : -CH<sub>2</sub>-

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

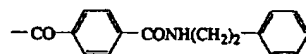
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 221

構造

R :



X : -CH<sub>2</sub>-

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗淨  
融点 : 143 - 144.5℃  
形態 : 遊離

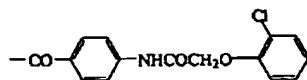
【0868】

【表163】

実施例 222

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

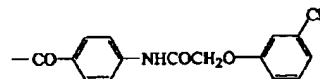
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 微橙色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル洗浄  
融点 : 231.5 - 233℃  
形態 : 遊離

実施例 223

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : エタノール  
融点 : 164 - 165℃  
形態 : 遊離

【0869】

【表164】

実施例 224

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 微黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

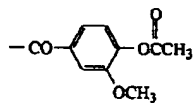
融点 : 175 - 176.5℃

形態 : 遊離

実施例 225

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 127.5 - 128.5℃

形態 : 遊離

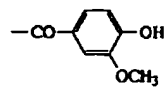
【0870】

【表165】

実施例 226

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

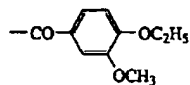
融点 : 176 - 177℃

形態 : 遊離

実施例 227

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 104.5 - 105.5℃

形態 : 遊離

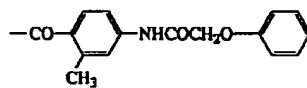
【0871】

【表166】

實施例 228

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

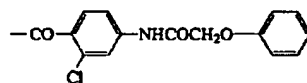
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 229

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 黃色不定形  
形態 : 遊離

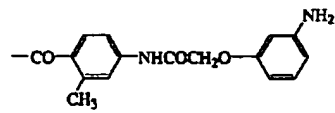
【0872】

【表167】

实施例 230

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

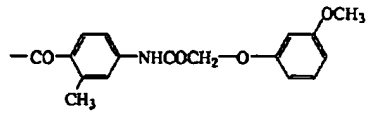
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

实施例 231

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 黄色不定形  
形態 : 遊離

【0873】

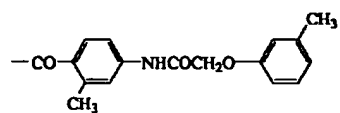
【表168】



实施例 232

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

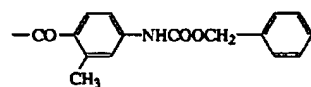
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 黄色不定形  
形態 : 遊離

实施例 233

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

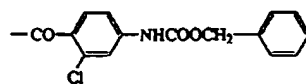
【0874】

【表169】

实施例 234

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

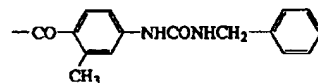
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 235

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

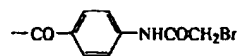
【0875】

【表170】

実施例 236

構造

R :



X :  $\text{---CH}_2\text{---}$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 茶色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

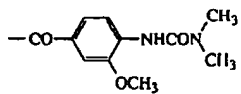
融点 : 156 - 159℃

形態 : 遊離

実施例 237

構造

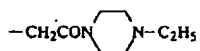
R :



X :  $\text{---CH}_2\text{---}$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

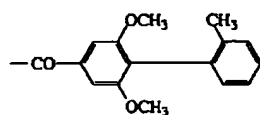
【0876】

【表171】

実施例 238

構造

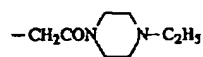
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



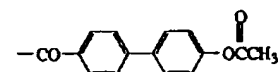
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 239

構造

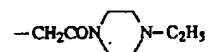
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

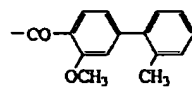
【0877】

【表172】

実施例 240

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

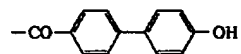
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 241

構造

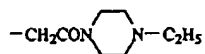
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

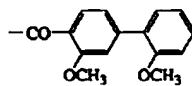
【0878】

【表173】

实施例 242

構造

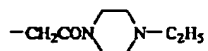
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

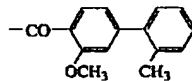
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

实施例 243

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

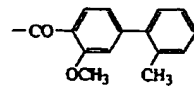
【0879】

【表174】

実施例 244

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{OCH}_2\text{COOH}$

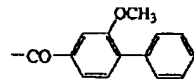
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 245

構造

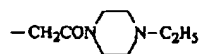
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

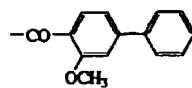
【0880】

【表175】

実施例 246

構造

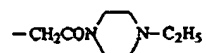
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



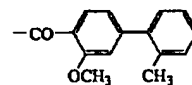
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 247

構造

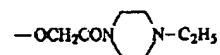
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

【0881】

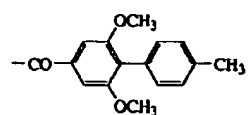
【表176】



実施例 248

構造

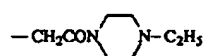
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

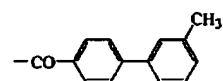
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 249

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒: アセトン-n-ヘキサン

融点 : 84 - 85.5℃

形態 : 遊離

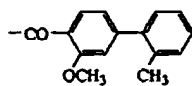
【0882】

【表177】

实施例 250

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

R<sup>3</sup> : H

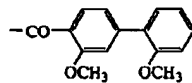
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

实施例 251

構造

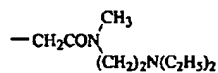
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

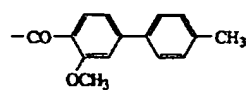
【0883】

【表178】

実施例 252

構造

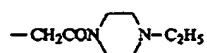
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



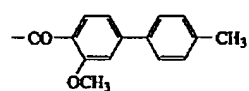
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 253

構造

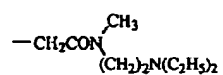
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

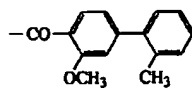
【0884】

【表179】

实施例 254

構造

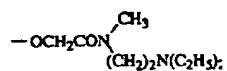
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

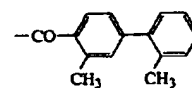
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

实施例 255

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

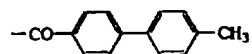
【0885】

【表180】

実施例 256

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

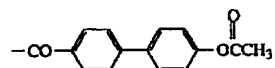
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 181.5 - 182℃  
形態 : 遊離

実施例 257

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 181 - 182℃  
形態 : 遊離

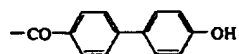
【0886】

【表181】

実施例 258

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

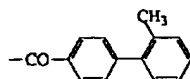
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 262 - 265℃  
形態 : 遊離

実施例 259

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 159 - 160℃  
形態 : 遊離

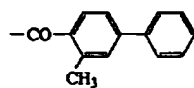
【0887】

【表182】

実施例 260

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

R<sup>3</sup> : H

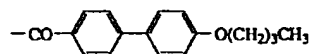
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 261

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン

融点 : 153℃

形態 : 遊離

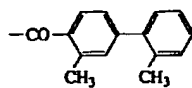
【0888】

【表183】

实施例 262

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

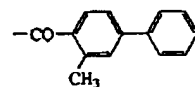
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 263

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : H

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0889】

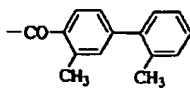
【表184】



実施例 264

構造

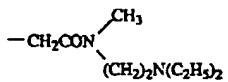
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



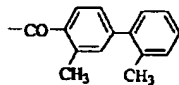
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 265

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONHCH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

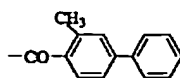
【0890】

【表185】

実施例 266

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$

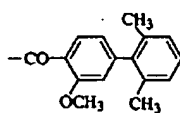
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 267

構造

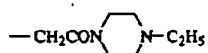
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

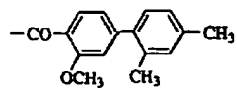
【0891】

【表186】

实施例 268

構造

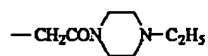
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

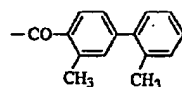
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

实施例 269

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

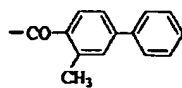
【0892】

【表187】

実施例 270

構造

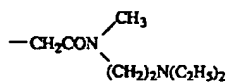
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



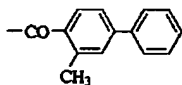
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 271

構造

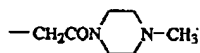
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

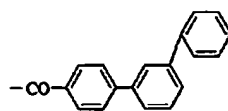
【0893】

【表188】

実施例 272

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

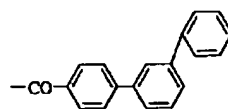
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 273

構造

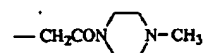
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

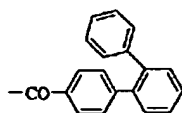
【0894】

【表189】

実施例 274

構造

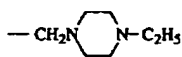
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



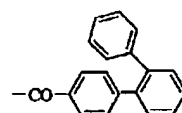
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 275

構造

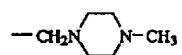
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

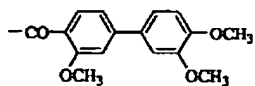
【0895】

【表190】

実施例 276

構造

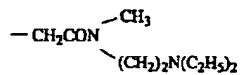
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

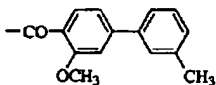
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 277

構造

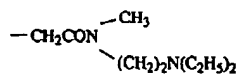
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

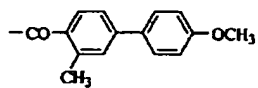
【0896】

【表191】

実施例 278

構造

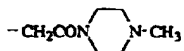
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



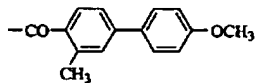
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 279

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0897】

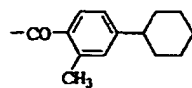
【表192】



実施例 280

構造

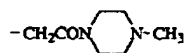
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



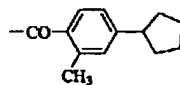
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : エタノール-*n*-ヘキサン  
融点 : 218 - 221℃  
形態 : HCl

実施例 281

構造

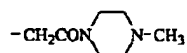
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 214 - 217℃  
形態 : HCl

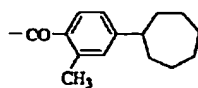
【0898】

【表193】

実施例 282

構造

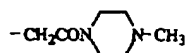
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

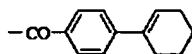
融点 : 204 - 206℃

形態 : HCl

実施例 283

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONHCH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

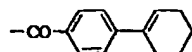
【0899】

【表194】

実施例 284

構造

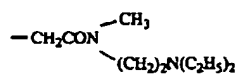
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



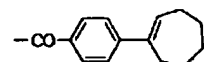
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 285

構造

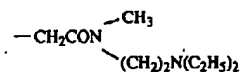
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

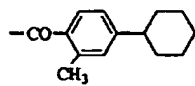
【0900】

【表195】

実施例 286

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



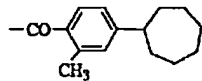
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 287

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

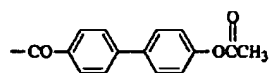
【0901】

【表196】

実施例 288

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

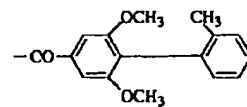
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 289

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

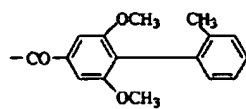
【0902】

【表197】

実施例 290

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

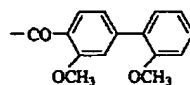
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 240 - 242℃  
形態 : 遊離

実施例 291

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

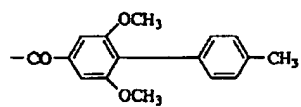
【0903】

【表198】

実施例 292

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

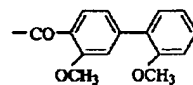
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 293

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

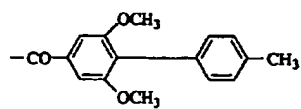
【0904】

【表199】

實施例 294

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

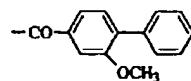
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 295

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0905】

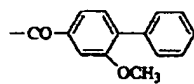
【表200】



実施例 296

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

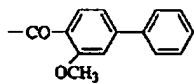
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 297

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

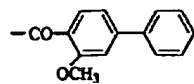
【0906】

【表201】

实施例 298

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

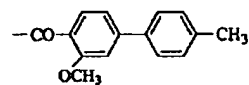
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 299

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

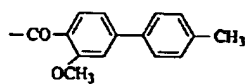
【0907】

【表202】

实施例 300

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

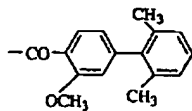
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 301

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

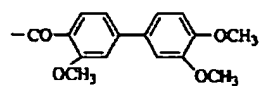
【0908】

【表203】

實施例 302

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

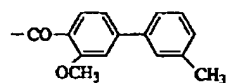
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 303

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

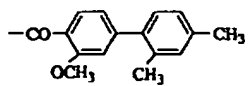
【0909】

【表204】

実施例 304

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

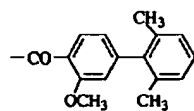
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 305

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色プリズム状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 251 - 253℃  
形態 : 遊離

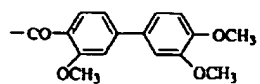
【0910】

【表205】

実施例 306

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

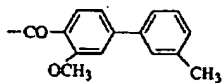
融点 : 128 - 131℃

形態 : 遊離

実施例 307

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

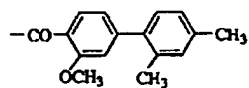
【0911】

【表206】

実施例 308

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : エタノール

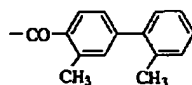
融点 : 224 - 225℃

形態 : 遊離

実施例 309

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

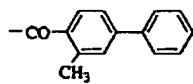
【0912】

【表207】

実施例 310

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

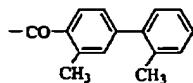
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 311

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【0913】

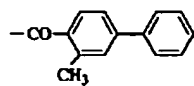
【表208】



實施例 312

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

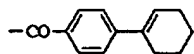
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 313

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

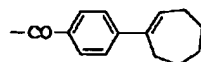
【0914】

【表209】

实施例 314

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

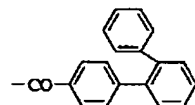
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 315

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

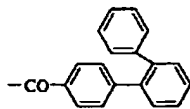
【0915】

【表210】

実施例 316

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

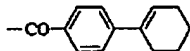
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色プリズム状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 124 - 128℃  
形態 : 遊離

実施例 317

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

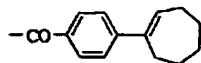
【0916】

【表211】

實施例 318

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

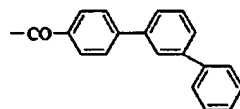
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 319

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

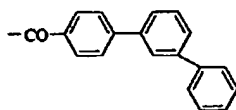
【0917】

【表212】

实施例 320

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

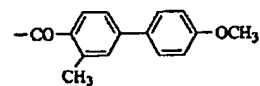
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 321

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

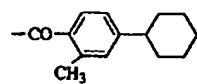
【0918】

【表213】

實施例 322

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

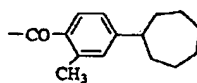
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

實施例 323

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

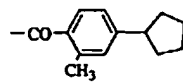
【0919】

【表214】

实施例 324

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

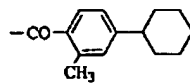
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 325

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

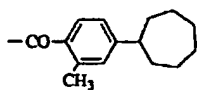
【0920】

【表2-1-5】

実施例 326

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

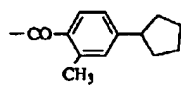
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 327

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

【0921】

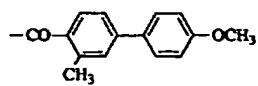
【表216】



实施例 328

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

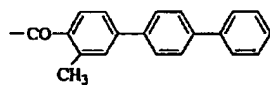
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 329

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

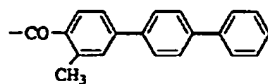
【0922】

【表217】

実施例 330

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

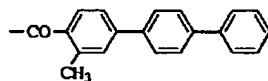
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 203 - 204℃  
形態 : 遊離

実施例 331

構造

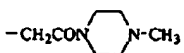
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン  
融点 : 255 - 258℃  
形態 : HCl

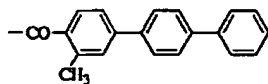
【0923】

【表218】

实施例 332

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

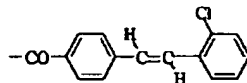
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 333

構造

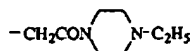
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色油状  
形態 : 遊離

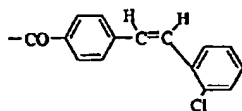
【0924】

【表219】

实施例 334

構造

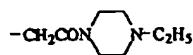
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



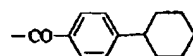
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

实施例 335

構造

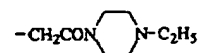
R :



X :  $=\text{CH}-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

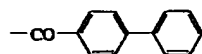
【0925】

【表220】

實施例 336

構造

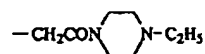
R :



X : =CH-

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

實施例 337

構造

R :



X : =CH-

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : -CH<sub>2</sub>CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

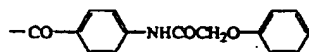
【0926】

【表221】

實施例 338

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状

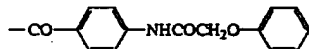
融点 : 102 - 106℃

形態 : 遊離

實施例 339

構造

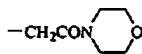
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

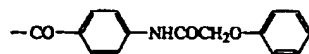
【0927】

【表222】

実施例 340

構造

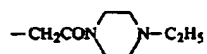
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



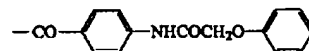
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : HCl

実施例 341

構造

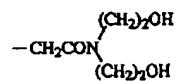
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

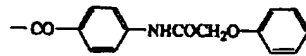
【0928】

【表223】

実施例 342

構造

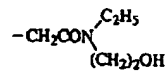
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



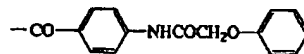
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 343

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色針状  
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール-ジエチルエーテル  
融点 : 190-193℃  
形態 : 遊離

【0929】

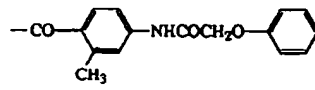
【表224】



實施例 344

構造

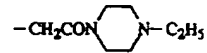
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



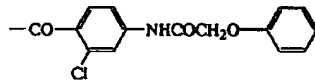
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色油狀  
形態 : 遊離

實施例 345

構造

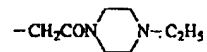
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色粘稠油狀  
形態 : 遊離

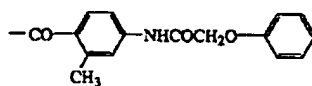
【0930】

【表225】

実施例 346

構造

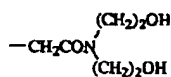
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :



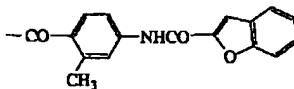
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

実施例 347

構造

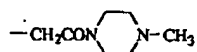
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル  
融点 : 180 - 182℃  
形態 : 遊離

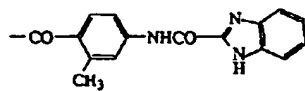
【0931】

【表226】

実施例 348

構造

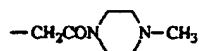
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジクロロメタン-ジエチルエーテル

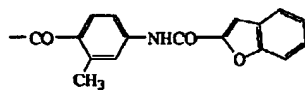
融点 : 239 - 241℃

形態 : 遊離

実施例 349

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 252 - 254℃

形態 : 遊離

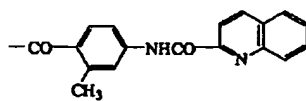
【0932】

【表227】

实施例 350

構造

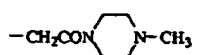
R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :



R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色粘稠油状  
形態 : 遊離

实施例 351

構造

R :



X :  $=\text{CH}-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 淡黄色粉末状  
融点 : 71 - 75℃  
形態 : 遊離

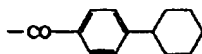
【0933】

【表228】

实施例 352

构造

R :



X : =CH-

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : -CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

R<sup>3</sup> : H

结晶形 : 淡黄色油状

形态 : 游离

实施例 353

构造

R :



X : =CH-

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : -CH<sub>2</sub>COOH

R<sup>3</sup> : H

结晶形 : 白色粉末状

形态 : 游离

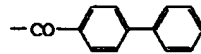
【0934】

【表229】

实施例 354

構造

R :



X : =CH-

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> : -CH<sub>2</sub>COOH

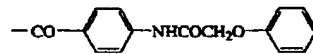
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

实施例 355

構造

R :



X : -CH<sub>2</sub>-

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> : -CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
融点 : 63 - 69℃  
形態 : 遊離

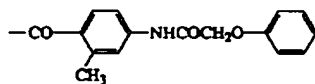
【0935】

【表230】

实施例 356

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

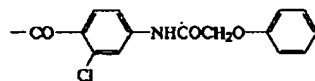
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 白色粉末状  
形態 : 遊離

实施例 357

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 淡黄色粉末状  
形態 : 遊離

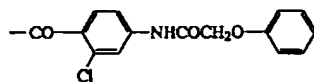
【0936】

【表231】

實施例 358

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

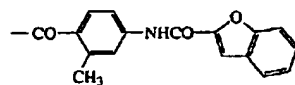
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色粘稠油狀  
形態 : 遊離

實施例 359

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色粘稠油狀  
形態 : 遊離

【0937】

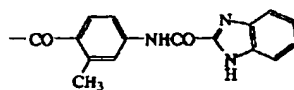
【表232】



实施例 360

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

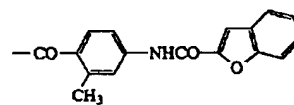
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色粘稠油状  
形態 : 遊離

实施例 361

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

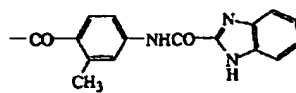
【0938】

【表233】

实施例 362

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : 7-Cl

R<sup>2</sup> :  $-\text{CH}_2\text{COOH}$

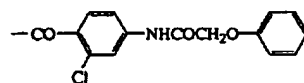
R<sup>3</sup> : H

結晶形 : 無色不定形  
形態 : 遊離

实施例 363

構造

R :



X :  $-\text{CH}_2-$

R<sup>1</sup> : H

R<sup>2</sup> 及び R<sup>3</sup> : =O

結晶形 : 淡黄色不定形  
形態 : 遊離

【0939】

【表234】